

Pesticide based on aminopyrimidine derivatives, and aminopyrimidine compounds.

Publication number: EP0248348

Publication date: 1987-12-09

Inventor: GIENCKE WOLFGANG DR; MILDENBERGER HILMAR DR; HEUBACH GUNTHER DR; SACHSE BURKHARD DR; FUSS ANDREAS DR; WALTERSDORFER ANNA DR; KNAUF WERNER DR; KERN MANFRED DR; BONIN WERNER DR

Applicant: HOECHST AG (DE)

Classification:

- International: **A01N43/54; C07D239/42; C07D239/46; C07D239/47; C07D239/48; A01N43/48; C07D239/00; (IPC1-7): A01N43/54; C07D239/42**

- European: A01N43/54; C07D239/42B1; C07D239/42B3; C07D239/42C2; C07D239/42C5; C07D239/46C3; C07D239/46C4

Application number: EP19870107729 19870527

Priority number(s): DE19863618353 19860531

Also published as:



JP62286973 (A)
DE3618353 (A1)
BR8702772 (A)

Cited documents:



EP0126254
EP0139613
EP0067630

Report a data error here

Abstract of EP0248348

Pesticides which contain a compound of the formula (I) in which R1 and R2 represent hydrogen; halogen, cyano; (subst.) alkyl; (subst.) cycloalkyl; (halo)alkenyl; cycloalkylenyl; a group N(R8)(R9); alkylthio; (halo)alkoxy; alkylsulphonyl; (subst.) phenyl or (subst.) phenoxy; R3 represents hydrogen, halogen; (halo)alkyl; (halo)alkenyl; alkoxy; alkylthio; cyano; nitro; (subst.) phenyl or (subst.) phenoxy; R4 represents hydrogen, halogen, alkylthio, (subst.) amino, alkoxy or (subst.) phenoxy and R5 and R6 represent nitro or CF₃, are advantageously suitable in controlling animal pests in crop protection. Compounds of the formula I in which R1 is CCl₃ are novel and are also valuable fungicides.

Data supplied from the **esp@cenet** database - Worldwide

(19)



Europäisches Patentamt
European Patent Office
Office européen des brevets

(11)

Veröffentlichungsnummer:

0 248 348
A1

(12)

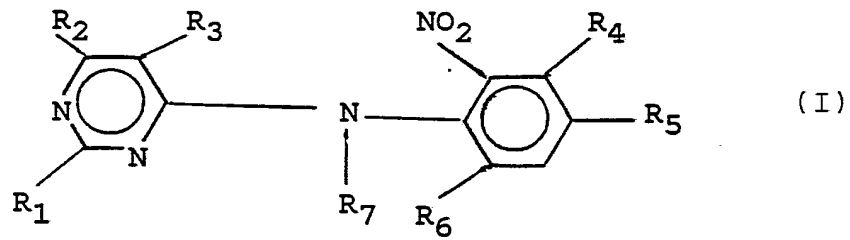
EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: **87107729.3**(51) Int. Cl.4: **A01N 43/54**, C07D 239/42(22) Anmeldetag: **27.05.87**(30) Priorität: **31.05.86 DE 3618353**(43) Veröffentlichungstag der Anmeldung:
09.12.87 Patentblatt 87/50(84) Benannte Vertragsstaaten:
AT BE CH DE ES FR GB GR IT LI NL SE(71) Anmelder: **HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT**
Postfach 80 03 20
D-6230 Frankfurt am Main 80(DE)

(72) Erfinder: **Giencke, Wolfgang, Dr.**
Am Steinberg 45
D-6238 Hofheim am Taunus(DE)
Erfinder: **Mildenberger, Hilmar, Dr.**
Fasanenstrasse 24
D-6233 Kelkheim (Taunus)(DE)
Erfinder: **Heubach, Günther, Dr.**
Luisenstrasse 15
D-6233 Kelkheim (Taunus)(DE)
Erfinder: **Sachse, Burkhard, Dr.**
An der Ziegelei 30
D-6233 Kelkheim (Taunus)(DE)
Erfinder: **Fuss, Andreas, Dr.**
Lindigstrasse 24
D-8757 Karlstein(DE)
Erfinder: **Waltersdorfer, Anna, Dr.**
Rauenthaler Weg 28
D-6000 Frankfurt am Main(DE)
Erfinder: **Knauf, Werner, Dr.**
Im Kirschgarten 24
D-6239 Eppstein/Taunus(DE)
Erfinder: **Kern, Manfred, Dr.**
Im Traminer Weg 8
D-6501 Lörzweiler(DE)
Erfinder: **Bonin, Werner, Dr.**
Im Schulzehnten 18
D-6233 Kelkheim (Taunus)(DE)

EP 0 248 348 A1

(54) **Schädlingsbekämpfungsmittel auf der Basis von Aminopyrimidin-Derivaten sowie neue Amino-pyrimidin-Verbindungen.**(57) **Schädlingsbekämpfungsmittel, die eine Verbindung der Formel (I) enthalten,**



worin

R₁ und R₂ Wasserstoff; Halogen, Cyano; (Subst.)Alkyl; (Subst.)Cycloalkyl; (Halo)alkenyl; Cycloalkylenyl; eine Gruppe N(R₈)(R₉); Alkylthio; (Halo)alkoxy; Alkylsulfonyl; (Subst.)Phenyl oder (Subst.)Phenoxy; R₃ Wasserstoff, Halogen; (Halo)alkyl; (Halo)alkenyl; Alkoxy; Alkylthio; Cyano; Nitro; (Subst.)Phenyl oder (Subst.)Phenoxy; R₄ Wasserstoff, Halogen, Alkylthio, (Subst.)Amino, Alkoxy oder (Subst.)Phenoxy; R₅, R₆ Nitro oder CF₃ bedeuten, eignen sich vorteilhaft zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen im Pflanzenschutz. Verbindungen der Formel I, worin R₁ CCl₃ bedeuten, sind neu und stellen auch wertvolle Fungizide dar.

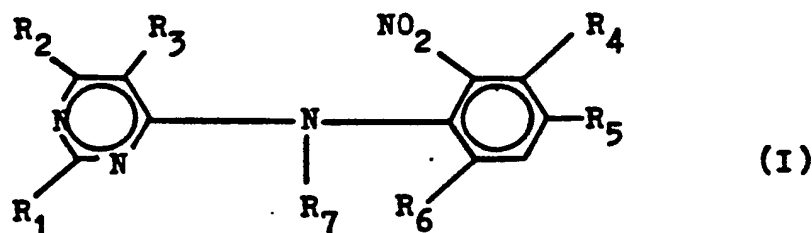
Schädlingsbekämpfungsmittel auf der Basis von Aminopyrimidin-Derivaten sowie neue Aminopyrimidin-Verbindungen

N-(2-Nitrophenyl)-4-aminopyrimidin-Derivate zeigen fungizide und auch insektizider Wirkung (vgl. EP-A 31257).

Ferner ist bekannt, daß N-(2-Nitrophenyl)-4-aminopyrimidin-Derivate fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. EP-A 139613).

Überraschenderweise wurde nun festgestellt, daß N-(2-Nitrophenyl)-4-aminopyrimidin-Derivate ausgezeichnete Insektizide sind, die sich vorteilhaft zum Einsatz im Pflanzenschutz eignen.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind demnach Schädlingsbekämpfungsmittel, die eine Verbindung der allgemeinen Formel (I),



worin

R₁ und R₂ unabhängig voneinander Wasserstoff; Halogen; Cyano; (C₁-C₈)-Alkyl; (C₁-C₈)-Haloalkyl; (C₁-C₈)-Alkyl, das ein-oder zweifach durch Nitro, Cyano, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio oder -N(R₈)(R₉) substituiert ist; (C₃-C₈)-Cycloalkyl, das durch (C₁-C₄)-Alkyl substituiert sein kann; (C₂-C₄)-Alkenyl; (C₂-C₄)-Haloalkenyl; (C₅-C₈)-Cycloalkenyl; eine Gruppe N(R₈)(R₉); (C₁-C₈)-Alkylthio; (C₁-C₈)-Alkoxy; (C₁-C₈)-Haloalkoxy; (C₁-C₈)-Alkylsulfonyl; Phenyl, das gegebenenfalls durch Halogen, Nitro, Cyano (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio oder (C₁-C₄)-Haloalkyl substituiert sein kann oder Phenoxy, das ein-bis einfach durch Halogen, NO₂, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy substituiert sein kann;

R₃ Wasserstoff, Halogen; (C₁-C₈)-Alkyl; (C₁-C₈)-Haloalkyl; (C₂-C₄)-Alkenyl; (C₂-C₄)-Haloalkenyl; (C₁-C₄)-Alkoxy; (C₁-C₄)-Alkylthio; Cyano; Nitro; Phenyl, das ein-bis dreifach durch Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio oder (C₁-C₄)-Haloalkyl substituiert sein kann; oder Phenoxy, das ein-bis dreifach durch Halogen, NO₂, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy substituiert sein kann,

R₄ Wasserstoff, Halogen, (C₁-C₄)-Alkoxy; (C₁-C₄)-Alkylthio, eine Gruppe N(R₈)(R₉) oder Phenoxy, das ein-bis dreifach durch Halogen, Nitro, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy substituiert sein kann;

R₅ und R₆ unabhängig voneinander Nitro oder CF₃;

R₇ Wasserstoff, eine Gruppe -COR₁₀ oder ein Kationäquivalent,

R₈ und R₉ unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁-C₄)-Alkyl oder (C₃-C₇)-Cycloalkyl und

R₁₀ Wasserstoff oder (C₁-C₄)-Alkyl bedeuten, enthalten.

Unter einem "Kationäquivalent" sind die in der Landwirtschaft einsetzbaren Kationen, insbesondere Alkali-oder Erdalkali-Ionen sowie gegebenenfalls ein-bis vierfach durch (C₁-C₄)-Alkyl oder (C₁-C₄)-Hydroxyalkyl substituiertes Ammonium zu verstehen.

Der Begriff Halogen beinhaltet Fluor, Chlor, Brom und Jod.

Die Vorsilbe "Halo" in der Bezeichnung eines Substituenten bedeutet hier und im folgenden, daß dieser Substituent einfach oder mehrfach bei gleicher oder verschiedener Bedeutung auftreten kann. Die Vorsilbe Halo beinhaltet Fluor, Chlor, Brom und Jod, insbesondere Chlor und Brom.

Als Haloalkyl-Reste seien beispielsweise genannt; CF₃, CHF₂, CH₂F, CCl₃, CHCl₂, CH₂Cl, CBr₃, CF₂Cl, CClF₂, CF₂CHF₂, CF₂CF₃, CF₂CHClF, CF₂CHCl₂, CCl₂CCl₃, n-C₃F₇, CH(CF₃)₂, CF₂CHF₂CF₃, n-C₄F₉, n-C₅F₁₁, n-C₆F₁₃, n-C₇F₁₅ und n-C₈F₁₇. Als Beispiele für (C₂-C₄)-Haloalkenyl seien genannt: CH₂=CF-, F₂C=CF- und Cl₂C=CCl-.

Bevorzugte erfindungsgemäß einzusetzende Verbindungen der Formel I sind solche, bei denen R₁, R₂ = (C₁-C₈)-Alkyl, (C₁-C₈)-Haloalkyl; (C₁-C₈)-Alkyl, das ein-oder zweifach durch Nitro, Cyano, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio oder -N(R₈)(R₉) substituiert ist, (C₃-C₈)-Cycloalkyl, das durch (C₁-C₄)-Alkyl substituiert sein kann; (C₂-C₄)-Alkenyl; (C₂-C₄)-Haloalkenyl; Phenyl, das gegebenenfalls durch Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio oder (C₁-C₄)-Haloalkyl substituiert sein kann,

R₃ Wasserstoff, Halogen; (C₁-C₈)-Alkyl; (C₁-C₈)-Haloalkyl; Cyano oder Phenoxy, das ein-bis dreifach durch Halogen, NO₂, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy substituiert sein kann;

R₄ Wasserstoff; Halogen, (C₁-C₄)-Alkoxy oder (C₁-C₄)-Alkylthio;

R₅ und R₆ unabhängig voneinander Nitro oder CF₃;

5 R₇ Wasserstoff, eine Gruppe -COR₁₀ oder ein Kationäquivalent;

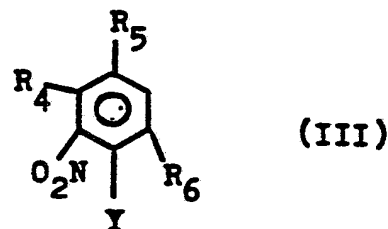
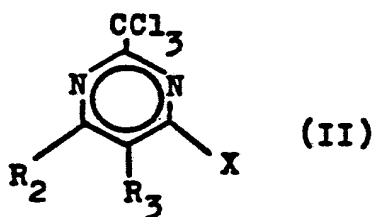
R₈ und R₉ unabhängig voneinander Wasserstoff; (C₁-C₄)-Alkyl oder (C₃-C₇)-Cycloalkyl und

R₁₀ Wasserstoff oder (C₁-C₄)-Alkyl bedeuten.

Insbesondere bevorzugt hiervon sind Verbindungen der Formel I, worin R₁ (C₁-C₈)-Haloalkyl, R₂ Wasserstoff, R₃ Halogen, R₄ Wasserstoff, R₅ und R₆ unabhängig voneinander NO₂ oder CF₃ und R₇ Wasserstoff bedeuten.

Verbindungen der Formel I, worin R₁ ausschließlich CCl₃ bedeutet und die Substituenten R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ und R₁₀ die im Vorstehenden beschriebenen Bedeutungen haben, sind neu und werden ebenfalls von der Erfindung umfaßt. Diese Verbindungen zeigen ausgezeichnete fungizide Wirkungen.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind auch Verfahren zur Herstellung der neuen Verbindungen der Formel I, worin R₁ ausschließlich CCl₃ bedeutet und die Substituenten R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ und R₁₀ die im Vorstehenden beschriebenen Bedeutungen haben, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindungen der Formel II in Gegenwart einer Base mit einer Verbindung der Formel III umsetzt.



Die Substituenten R₂ und R₃ in Formel II, sowie die Substituenten R₄, R₅ und R₆ in Formel III haben die gleichen Bedeutungen wie in der Formel I. X und Y stehen für Halogen oder NH₂ wobei in dem Fall, in dem X für Halogen steht, Y NH₂ bedeutet und in dem Fall, in dem Y für Halogen steht, X NH₂ bedeutet.

Der Begriff Halogen repräsentiert Fluor, Chlor, Brom und Jod, insbesondere Cl und Br. Die oben genannten Vorzugsbereiche für R₂ bis R₁₀ gelten auch in diesem Zusammenhang. Insbesondere sind als Fungizide jedoch geeignet solche Verbindungen, bei denen R₁ = CCl₃, R₂ = Halogen, (C₁-C₈)-Alkyl, (C₁-C₈)-Haloalkyl; R₃ = H, Halogen, Cyano; R₄ = H oder Halogen; R₅, R₆ = Nitro oder CF₃ und R₇ = H bedeuten.

Die Umsetzung der Verbindung II mit III erfolgt vorzugsweise in inerten aprotischen Lösungsmitteln wie z.B. Acetonitril, Dichlormethan, DMSO, Toluol, Xylol, Tetrahydrofuran, Dialkylether wie Diethylen glykoldimethylether, Dioxan oder Dioxan oder DMF bei Temperaturen zwischen -10 °C und der Siedetemperatur des Lösungsmittels. Als Basen eignen sich Carbonate und Hydrogencarbonate von Alkali- und Erdalkalimetallen, Alkalihydroxide, Alkalialkoholate wie K-tert.-butylat, tert. Amine, Pyridine und substituierte Pyridinbasen (z.B. 4-Dimethylaminopyridin).

Auch eine zweites Äquivalent der Verbindungen der allgemeinen Formel II kann die Funktion der Base übernehmen. Als Basen kommen nur diejenigen Verbindungen der Formel II in Betracht, in denen X für NH₂ steht und R₂ und R₃ die im Vorstehenden genannten Bedeutungen haben.

Die Umsetzung erfolgt sowohl in aprotischen Lösungsmitteln wie z.B. Acetonitril, Dichlormethan, Toluol, Xylol, Tetrahydrofuran, Dioxan oder DMF als auch in protischen Lösungsmitteln wie z.B. Methanol, Ethanol oder Isopropanol im Temperaturbereich von 0 °C bis zur Siedetemperatur des Lösungsmittels.

Die Verbindungen der Formel II lassen sich nach grundsätzlich bekannten Verfahren synthetisieren, vgl. z.B. US-PS 4 393 803 und J. Org. Chem. 26, 4504. Die Verbindungen der Formel III sind bekannt und ebenfalls nach Standardmethoden herstellbar.

Die erfindungsgemäßen Mittel eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblüttoxizität zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnentieren und Nematoden, ganz besonders bevorzugt zur Bekämpfung von Insekten, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten Schädlingen gehören: Aus der Ordnung der Isopoda z.B. Oniscus asellus, Armadillidium vulgare, Porcellio scaber.

Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. *Blaniulus guttulatus*.

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. *Geophilus carpophagus*, *Scutigera* spp.

Aus der Ordnung der Symphyla z.B. *Scutigera immaculata*.

Aus der Ordnung der Thysanura z.B. *Lepisma saccharina*.

5 Aus der Ordnung der Collembola z.B. *Onychiurus armatus*.

Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blatella germanica*, *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus differentialis*, *Schistocerca gregaria*.

Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. *Forficula auricularia*.

10 Aus der Ordnung der Isoptera z.B. *Reticulitermes* spp.,

Aus der Ordnung der Anoplura z.B. *Phylloera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp.

Aus der Ordnung der Mallophaga z.B. *Trichodectes* spp., *Damalinea* spp.

Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*.

15 Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadratum*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma* spp.

Aus der Ordnung der Homoptera z.B. *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Doralis fabae*, *Doralis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelus bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp.

20 Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella maculipennis*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp., *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Laphygma exigua*, *Mamestra brassicae*, *Panolis flamea*, *Prodenia litura*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephesia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Cacoecia podana*, *Capus reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*.

Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*, *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastics alni*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*, *Anthonomus* spp., *Sitophilus* spp., *Otiorynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hypera postica*, *Dermestes* spp., *Trogoderma* spp., *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus hololeucus*, *Gibbium psyllodes*, *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*, *Agriotes* spp., *Conoderus* spp., *Melolontha melolontha*, *Amphimallon solstitialis*, *Costelytra zealandica*.

35 Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.

Aus der Ordnung der Diptera z.B. *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Drosophila melanogaster*, *Musca* spp., *Fannia* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Lucilia* spp., *Chrysomya* spp., *Cuterebra* spp., *Gastrophilus* spp., *Hypobosca* spp., *Stomoxys* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Bibio hortulanus*, *Oscinella frit*, *Phorbia* spp., *Pegomya hyoscyami*, *Ceratitis capitata*, *Dacus oleae*, *Tipula paludosa*.

Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. *Xenopsylla cheopis*, *Ceratophyllus* spp.

Aus der Ordnung der Arachnida z.B. *Scorpio maurus*, *Latrodectus mactans*.

45 Auch können verschiedene Spinnmilbenarten, wie die Obstbaumspeinnmilbe (*Metatetranychus ulmi*), die Citruspeinnmilbe (*Panonychus citri*) und die Bohnenspeinnmilbe (*Tetranychus urticae*), darunter auch Phosphorsäureester-resistente Stämme, gut bekämpft werden.

Auch gegen Ektoparasiten bei Tieren sind die Verbindungen der Formel I ausgezeichnet wirksam. Sie besitzen sowohl eine gute Wirkung gegen permanenten und temporär parasitierende Insekten als auch gegen

50 Milben und insbesondere gegen Zecken.

Zu den tierischen Ektoparasiten aus der Klasse der Insekten, gegen die die Verbindungen der Formel (I) wirksam sind, gehören Läuse (Anoplura), Flöhe (Ceratophyllidae), Haar- und Federlinge (Mallophaga), ferner Fliegen, wie Stechfliegen (Stomoxysidae) und Bremsen (Tabanidae), sowie solche Fliegen, deren Entwicklungsformen (Larven) als Schädlinge im Tierkörper parasitieren (Calliphoridae, Sarcophagidae, Gastrophilidae, Oestridae) und schließlich Lausfliegen (Hippoboscidae). Ektoparasiten aus der Ordnung der

55

Milben (Acari) sind die Räudemilben (Sarcoptidae), Vogelmilben (Dermanyssidae), Lederzecken (Argasidae) und schließlich die Schildzecken (Ixodidae), darunter besonders die einwirtigen Rinderzecken *microplus* und *Boophilus decoloratus* sowie die mehrwirtigen Arten der Gattungen *Rhipicephalus*, *Amblyomma* und *Hyalomma*.

5 Es wurde ferner überraschenderweise gefunden, daß bei der Kombination von Verbindungen der Formel I mit bekannten Insektiziden und Akariziden synergistische Wirkungen auftreten.

Gegenstand der Erfindung sind daher auch Schädlingsbekämpfungsmittel, die die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem Insektizid aus der Gruppe der Phosphorsäureester, Nitrophenol-Derivate, Diarylcarbinole, Carbamate, Formamidine, Carbonsäureester, Zinnverbindungen, Thiazolidinon Derivate oder
10 Endosulfan enthalten. Darüber hinaus lassen sich die Verbindungen der Formel I auch mit anderen speziellen insektiziden Wirkstoffen, die im folgenden noch präzisiert werden, vorteilhaft kombinieren.

Von den erfindungsgemäß einzusetzenden Kombinationspartnern für die Verbindungen der Formel I seien genannt:

1. aus der Gruppe der Phosphorsäureester

15 Azinphos-ethyl, Azinphos-methyl, 1-(4-Chlorphenyl)-4-(O-ethyl, S-propyl)phosphoryloxypyrazol (TIA-230), Chlorpyrifos, Coumaphos, Demeton, Demeton-S-methyl, Diazinon, Dichlorvos, Dimethoat, Ethoprophos, Etrinfos, Fenitrothion, Fenthion, Heptenophos, Parathion, Parathion-methyl, Phosalon, Pirimiphos-ethyl, Pirimiphosmethyl, Profenofos, Prothiofos, Sulprofos, Triazophos, Trichlorphon.
Insbesondere bevorzugt sind Nicht-Thio-bzw. Dithiophosphorsäureester.

20 2. aus der Gruppe der Carbamate

Aldicarb, Bendiocarb, BPMC (2-(1-Methylpropyl)phenylmethylcarbamate), Butocarboxim, Butoxicarboxim, Carbaryl, Carbofuran, Carbosulfan, Cloethocarb, Methomyl, Isoprocab, Oxamyl, Pirmicarb, Promecarb, Propoxur, Thiodicarb.

3. aus der Gruppe der Carbonsäureester

25 Allethrin, Alphamethrin, Bioallethrin, Bioresmethrin, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cypermethrin, Deltamethrin, 2,2-Dimethyl-3-(2-chlor-2-trifluormethylvinyl)cyclopropanecarbonsäure-(α -cyano-3-phenyl-2-methylbenzyl)ester (FMC 54800), Fenpropathrin, Fenfluthrin, Fenvalerat, Flucythrinate, Flumethrin, Fluvalinate, Permethrin, Resmethrin, Tralomethrin.

4. aus der Gruppe der Formamidine

30 Amitraz, Chlordimeform

5. aus der Gruppe der Zinnverbindungen

Azocyclotin, Cyhexatin, Fenbutatinoxid

6. aus der Gruppe der Nitrophenol-Derivate

Binapacryl

35 7. aus der Gruppe der Diarylcarbinole

Dicofol

8. Andere geeignete Kombinationspartner für die Verbindungen der Formel I sind:

Bacillus thuringiensis, Bensultap, Bisclofentezin, Buprofecin, Cartrap, Cyromacin, Ethoproxyfen, Endosulfan, Fenoxycarb, Flubenzimin, Hexythiazox, 3-[2-(4-Ethoxyphenyl)-2-methyl-propoxymethyl]-1,3-diphenylether
40 (MTI-500), 5-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-2-fluor-1,3-diphenylether (MTI-800), 3-(2-Chlorphenyl)-3-hydroxy-2-(2-phenyl-4-thiazolyl)-propennitril (SN 72129), Thiocyclam, Kernpolyeder- und Granuloseviren.

Die obengenannten Wirkstoffe, für die common names angegebenen wurden, sind in CH.R. Worthin, S.B. Walker, The Pesticide Manual, 7th ed. British Crop. Protection Council (1983) beschrieben.

Die übrigen Verbindungen werden in folgenden Veröffentlichungen beschrieben:

45 TIA-230 : IUPAC Kongreß-Bericht, Pesticide Chemistry 1982, Kyoto Japan.

FMC 54800 : H.J. Doel et al., FMC 54800, A New Acaricide-Insecticide, Symposium Gent (1984)

MTI 500, MTI 800 : Recent Advances in the Chemistry of Insect Control, Int., Symposium 25-27 Sept. 1984, Cambridge

SN 72129 : E.P. Pieters et al., Field Experiences with SN 72129, A New Selective Insecticide, 17th Int.
50 Congress of Entomology 1984, Hamburg.

Die insektizide und akarizide Wirksamkeit der erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen liegt teilweise deutlich höher als von den Wirkungen der Einzelkomponenten zu erwarten war. Durch Anwendung dieser Kombinationen können daher die Aufwandmengen der Einzelkomponenten reduziert werden. Ihre Anwendung bringt demzufolge ökonomische wie auch ökologische Vorteile.

55 Die erfindungsgemäßen Mittel eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblütertoxizität zur Bekämpfung der obengenannten Schädlinge.

Die Verbindungen der Formel I, insbesondere solche worin R₁ ausschließlich CCl₃ bedeutet und die Substituenten R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ und R₁₀ die im Vorstehenden beschriebenen Bedeutungen haben, zeichnen sich auch durch eine hervorragende fungizide Wirkung aus. Bereits in das pflanzliche Gewebe eingedrungene pilzliche Krankheitserreger lassen sich erfolgreich kurativ bekämpfen. Dies ist besonders wichtig und vorteilhaft bei solchen Pilzkrankheiten, die nach eingetretener Infektion mit den sonst üblichen Fungiziden nicht mehr wirksam bekämpft werden können. Das Wirkungsspektrum der beanspruchten Verbindungen erfaßt eine Vielzahl verschiedener wirtschaftlich wichtiger, phytopathogener Pilze, wie z.B. *Piricularia oryzae*, *Pellicularia sasakii*, verschiedene Rostarten, *Venturia inaequalis*, *Cercospora*-Arten, *Plasmopara viticola*, *Pseudoperonospora cubensis* und *Phytophthora infestans*. Besonders gut werden Benzimidazol- und Dicarboximidsensible und -resistente *Botrytis cinerea*-Stämme erfaßt, sowie BCM sensible und resistente *Pseudocercospora herpotrichoides* Stämme.

Die Verbindungen der Formel I, insbesondere solche worin R₁ ausschließlich CCl₃ bedeutet und die Substituenten R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ und R₁₀ die im Vorstehenden beschriebenen Bedeutungen haben, eignen sich auf für den Einsatz in technischen Bereichen, beispielsweise als Holzschutzmittel, als Konservierungsmittel in Anstrichfarben, in Kühlschmiermitteln für die Metallbearbeitung oder als Konservierungsmittel in Bohr- und Schneidölen.

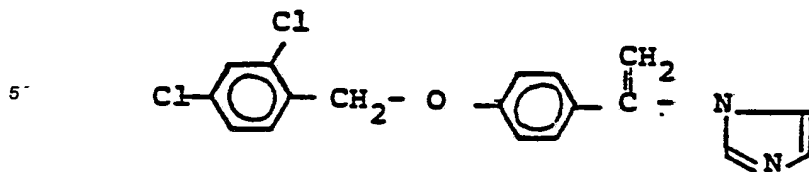
Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind daher auch fungizide Mittel, die Verbindungen der Formel I mit R₁ = CCl₃ enthalten.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind auch Kombinationen der Verbindungen der Formel I mit einem weiteren Fungizid.

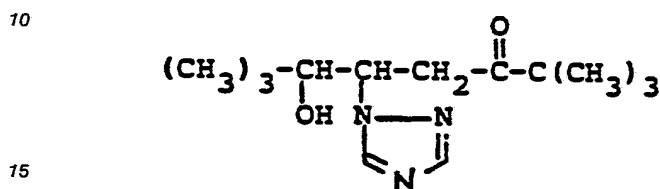
Als Fungizide, die erfindungsgemäß mit den Verbindungen der Formel I kombiniert werden können, sind folgende Wirkstoffe zu nennen.

Imazalil, Prochloraz, Fenapanil, SSF105, Triflumizol, PP969, Flutriafol, BAY-MEB 6401, Propiconazol, Etaconazol, Diclobutrazol, Bitertanol, Triadimefon, Triadimenol, Fluotrimazol, Tridemorph, Dodemorph, Fenpropimorph, Falimorph, S-32165, Chlobenzthiazole, Parinol, Buthiobat, Fenpropidin, Triforine, Fenarimol, Nuarimol, Triarimol, Ethirimol, Dimethirimol, Bupirimate, Rabenzazole, Tricyclazole, Ofurace, Furalaxyl, Benalazyl, Metalaxyl, Pencyuron, Oxadixyl, Cyprofuram, Dichlomezin, Probenazole, Fluobenzimine, Pyroxyfur, NK-483, PP-389, Pyroquilon, Hymexazole, Fenitropan, UHF-8227, Tolclofosmethyl, Ditalimfos, Edifenphos, Pyrazophos, Isoprothiolane, Cymoxanil, Dichloruanid, Captan, Folpet, Tolyfluanid, Chlorothalonil, Etridiazol, Iprodione, Procymidon, Vinclozolin, Metomeclan, Myclozolin, Dichlozolate, Fluorimide, Drazoxolon, Chinomethionate, Nitrothalisopropyl, Dithianon, Dinocap, Binapacryl, Fentinacetate, Fentinhydroxide, Carboxin, Oxycarboxin, Pyracarbolid, Methfuroxam, Fenfuram, Furmecyclox, Benodanil, Mebenil, Mepronil, Flutolanil, Fuberidazole, Thiabendazole, Carbendazim, Benomyl, Thiofanate, Thiofanate-methyl, CGO-94240F, IKF-1216, Mancozeb, Maneb, Zineb, Nabam, Thiram, Probineb, Prothiocarb, Propamocarb, Dodine, Guazatine, Dicloran, Quintozene, Chloroneb, Tecnazene, Biphenyl, Anilazine, 2-Phenylphenol, Kupferverbindungen wie Cu-oxychlorid, Oxine-Cu, Cu-oxide, Schwefel, Fosetylaluminium, Natrium-dodecylbenzolsulfonat, Natrium-dodecylsulfat, Natrium-C13/C15-alkoholethersulfonat, Natrium-cetostearylphosphatester, Dioctyl-natriumsulfosuccinat, Natrium-isopropyl-naphthalinsulfonat, Natrium-methylenbisnaphthalinsulfonat, Cetyl-trimethyl-ammoniumchlorid, Salze von langkettigen primären, sekundären oder tertiären Aminen, Alkyl-propylenamine, Lauryl-pyridiniumbromid, Ethoxilierte quaternierte Fettamine,, Alkyl-dimethyl-benzyl-ammoniumchlorid und 1-Hydroxyethyl-2-alkyl-imidazolin.

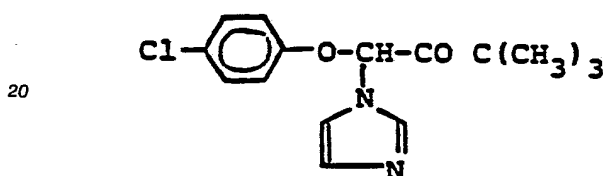
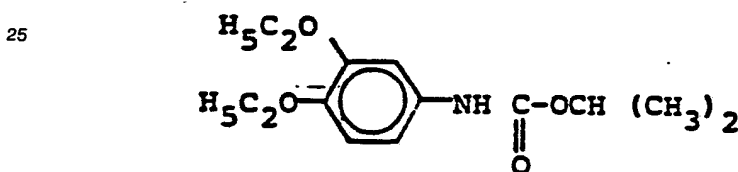
Die genannten Kombinationspartner stellen alle bekannte Wirkstoffe dar, die zum großen Teil in CH. R. Worthing, S.B. Walker, The Pesticide Manual, 7. Auflage (1983), British Crop Protection Council beschrieben sind. Verbindungen, für die Nummerncodes angegeben sind, besitzen folgende Strukturen:



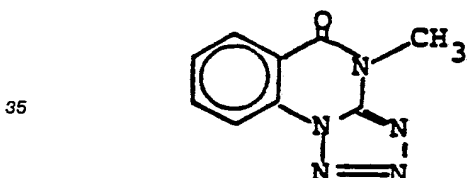
SS F 105



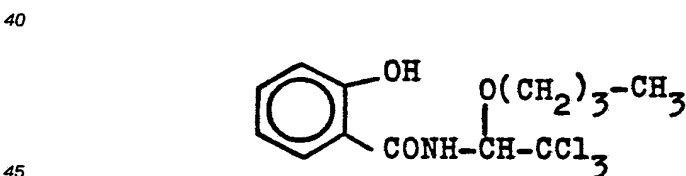
PP 969

Bay-Meb
6401

S - 32165



PP - 389



NK-483

35

40

45

Unerwarteterweise ist die fungizide Wirkung dieser Wirkstoffkombinationen in vielen Fällen höher, als die Summe der Wirkung der Einzelkomponenten, die nach der sogenannten Colby-Formel berechnet wird, vgl. S.R. Colby, Weeds 15, 20-22 (1967). Damit zeigen die Wirkstoffkombinationen synergistische Effekte. Die Gewichtsverhältnisse der Wirkstoffgruppen in den Wirkstoffkombinationen können in relativ großen Bereichen schwanken. Im allgemeinen entfallen auf 1 Gew.-Teil der Formel I 0,0005 bis 10 Gew.-Teile Wirkstoff, vorzugsweise 0,001 bis 2,5 Gew.-Teile des Kombinationspartners.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen weisen eine starke biozide Wirkung auf und können daher vorteilhaft zur Bekämpfung von Mikroorganismen, insbesondere im Pflanzenschutz, eingesetzt werden. Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut und des Bodens.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen haben ein sehr breites Wirkungsspektrum und können angewandt werden gegen parasitäre Pilze, die oberirdische Pflanzenteile befallen oder die Pflanzen vom Boden aus angreifen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen zeigen eine ausgezeichnete Wirkung als Saatgutbeizmittel gegen phytopathogene Pilze, wie z.B. Tilletia-, Urocystis-, Ustilago-, Septoria-, Typhula-, Rhynchosporium-, Helminthosporium- und Fusarium-Arten.

Auch als Bodenbekämpfungsmittel lassen sie sich zur Bekämpfung phytopathogener Pilze einsetzen, die Wurzelfäulen und Tracheomykosen verursachen wie z.B. Krankheitserreger der Gattungen Pythium, Verticillium, Phialophora, Rhizoctonia, Fusarium und Thielaviopsis.

Bei direkter Applikation der Wirkstoffkombinationen auf die oberirdischen Pflanzenteile lassen sich eine Vielzahl wirtschaftlich wichtiger Krankheitserreger hervorragend kontrollieren, wie z.B. echte MehltauPilze (Erysiphe-, Uncinula-, Sphaerotheca-, Podosphaera-Arten, Leveillula taurica), Rostpilze, Ventura-Arten, Cercospora-Arten, Alternaria-Arten, Botrytis-Arten, Phytophthora-Arten, Peronospora-Arten, Pyricularia oryzae und Pellicularia sasakii.

Die erfindungsgemäßen Mittel können als Spritzpulver, emulgierbare Konzentrate, versprühbare Lösungen, Stäubemittel, Beizmittel, Dispersionen, Granulate oder Mikrogranulate in den üblichen Zubereitungen angewendet werden.

Spritzpulver sind in Wasser gleichmäßig dispergierbare Präparate, die neben dem Wirkstoff außer gegebenenfalls einem Verdünnungs- oder Inerstoff noch Netzmittel, z.B. polyoxethylierte Alkylphenole, polyoxethylierte Fettalkohole, Alkyl- oder Alkylphenylsulfonate und Dispergiemittel, z.B. ligninsulfonsaures Natrium, 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium, dibutyl-naphthalinsulfonsaures Natrium oder auch oleoymethyltaurinsaures Natrium enthalten. Ihre Herstellung erfolgt in üblicher Weise z.B. durch Mahlen und Vermischen der Komponenten.

Emulgierbare Konzentrate können z.B. durch Auflösen des Wirkstoffes in einem inerten organischen Lösungsmittel, z.B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen unter Zusatz von einem oder mehreren Emulgatoren hergestellt werden. Bei flüssigen Wirkstoffen kann der Lösungsmittelanteil auch ganz oder teilweise entfallen. Als Emulgatoren können beispielsweise verwandt werden: Alkylarylsulfonsaure Calciumsalze wie Ca-dodecylbenzolsulfonat oder nichtionische Emulgatoren wie Fettsäurepolyglykolester, Alkylarylpolyglykolether, Fettalkoholpolyglykolether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Alkylpolyether, Sorbitanfettsäureester, Polyoxethylensorbitanfettsäureester oder Polyoxethylensorbitester.

Stäubemittel kann man durch Vermahlen des Wirkstoffes mit fein verteilten festen Stoffen, z.B. Talkum, natürlichen Tonen wie Kaolin, Bentonit, Poryphillit oder Diatomeenerde erhalten.

Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial hergestellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentrationen mittels Bindemitteln, z.B. Polyvinylalkohol, polyacrylsaurem Natrium oder auch Mineralölen auf die Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite, oder von granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise - gewünschtenfalls in Mischung mit Düngemitteln - formuliert werden.

In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration z.B. etwa 10 bis 90 Gew.-%; der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 10 bis 80 Gew.-% betragen.

Staubförmige Formulierungen enthalten meistens 5 bis 20 Gew.-% an Wirkstoff, versprühbare Lösungen etwa 2 bis 20 Gew.-%. Bei Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierhilfsmittel, Füllstoffe usw. verwendet werden.

Daneben enthalten die genannten Wirkstoffformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergier-, Emulgier-, Penetrations-, Lösungsmittel, Füll- oder Trägerstoffe.

Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Konzentrate gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt, z.B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und teilweise auch bei Mikrogranulaten mittels Wasser. Staubförmige und granuliert zubereitungen sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.

Auch Mischungen oder Mischformulierungen mit anderen Wirkstoffen, wie z.B. Insektiziden, Akariziden, Herbiziden, Düngemitteln und Wachstumsregulatoren sind gegebenenfalls möglich.

Die benötigten Aufwandmengen der Wirkstoffe der Formel I können je nach Indikation innerhalb weiter Grenzen schwanken und variieren auch in Abhängigkeit von äußeren Bedingungen wie Bodenverhältnissen und Klimabedingungen. Im allgemeinen liegen sie jedoch zwischen 0,005 - 10 kg Wirkstoff/ha.

Die Erfindung wird durch nachstehende Beispiele erläutert.

A. FormulierungsbeispieleBeispiel A:

- 5 Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man
 10 Gewichtsteile Wirkstoff
 und 90 Gewichtsteile Talkum
 als Interstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.

10

Beispiel B:

- Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man
 25 Gewichtsteile Wirkstoff
 15 64 Gewichtsteile kaolinhaltigen Quarz als Inerstoff
 10 Gewichtsteile ligninsulfonsäures Kalium
 und 1 Gewichtsteil olionylmethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel
 mischt und in einer Stößmühle mahlt.

20

Beispiel C:

- Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat wird erhalten, indem man
 20 Gewichtsteile Wirkstoff mit
 25 6 Gewichtsteile Alkylphenolpolyglykolether (Triton X 207)
 3 Gewichtsteilen Isotridecanolpolyglykoläther (8 AeO)
 und 71 Gewichtsteilen paraffinischem Mineralöl (Siedebereich z.B. ca. 255 bis über 377 °C)
 mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.

30

Beispiel D:

- Ein emulgierbares Konzentrat wird erhalten aus
 15 Gewichtsteilen Wirkstoff
 35 75 Gewichtsteilen Cyclohexanon als Lösungsmittel
 und 10 Gewichtsteilen oxäthyliertes Nonylphenol (10 AeO) als Emulgator.

Beispiel E:

- 40 Ein Stäubemittel wird erhalten, in dem man
 20 % Wirkstoff
 20 % Kombinationspartner
 10 % ®Dispersogen A (Kondensationsprodukt von Naphthalinsulfonsäure und Formaldehyd)
 45 15 % Zellpech
 5 % ®Leonil DB (Na-Salz einer Alkyl-naphthalinsulfonsäure)
 2 % ®Hostapon T (Na-Salz von Oleylmethyltaurid)
 5 % ®Mowiol 3-83 (teilverseiftes Polyvinylacetat)
 und 23 % ®Sipernat 225 (synthet. SiO₂)
 50 mischt und in einer Schlagkreuzmühle vermahlt.

Beispiel F:

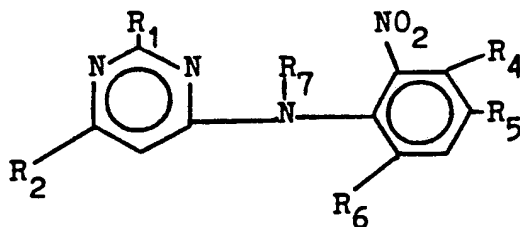
- 55 Ein emulgierbares Konzentrat wird erhalten aus 10 % Wirkstoff, 10 % Kombinationspartner, 10 %
 ®Emulsogen EC 400, 50 % Phenylsulfonat-Ca, 30 % Xylol und 35 % Isophoron.

B. Chemische Beispiele

Beispiele für Verbindungen der Formel I sind in den Tabellen 1 bis 11 beschrieben.

- Beispiele für die neuen Verbindungen der Formel I, worin R_1 ausschließlich CCl_3 bedeutet und die Substituenten $R_2, R_3, R_4, R_5, R_6, R_7, R_8, R_9$ und R_{10} die im Vorstehenden beschriebenen Bedeutungen haben, sind in der Tabelle 11 aufgelistet.

Tabelle 1

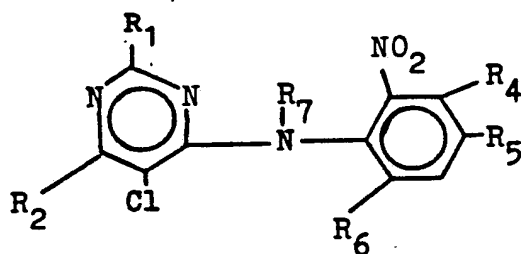


Nr.	R_1	R_2	R_4	R_5	R_6	R_7	physik. Konstanten [°C]
1.1	H	H	H	CF_3	NO_2	H	Smp. 156
1.2	H	Cl	Cl	CF_3	NO_2	H	Smp. 97-100
1.3	CH_3	H	Cl	CF_3	NO_2	H	
1.4	Δ	H	H	CF_3	NO_2	H	
1.5	CF_3	H	H	CF_3	NO_2	H	Harz
1.6	C_2F_5	H	H	CF_3	NO_2	H	
1.7	CF_2CHF_2	H	H	CF_3	NO_2	H	Smp. 206-208
1.8	C_3F_7	H	H	CF_3	NO_2	H	
1.9	H	OCH_2CF_3	Cl	CF_3	NO_2	H	Smp. 98-100
1.10	CF_3	H	Cl	CF_3	NO_2	H	Sirup
1.11	C_2F_5	H	Cl	CF_3	NO_2	H	
1.12	CF_2CHF_2	H	Cl	CF_3	NO_2	H	
1.13	CH_3	H	H	CF_3	NO_2	H	Smp. 109-111
1.14	H	SCH_3	Cl	CF_3	NO_2	H	Smp. 135-137
1.15	H	OCH_3	Cl	CF_3	NO_2	H	Smp. 128-129
1.16	$n\text{-C}_3\text{H}_7$	H	H	CF_3	NO_2	H	
1.17	$n\text{-C}_3\text{H}_7$	H	Cl	CF_3	NO_2	H	
1.18	C_6H_5	H	H	CF_3	NO_2	H	
1.19	CF_3	H	Cl	CF_3	NO_2	H	Harz
1.20	CF_3	H	H	NO_2	CF_3	H	Harz
1.21	C_2H_5	H	Cl	CF_3	NO_2	H	
1.22	$\text{C}\equiv\text{N}$	H	H	CF_3	NO_2	H	

Fortsetzung der Tabelle 1

Nr.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	physik. konstanten [°C]
1.23	C≡N	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
1.24	H	H	H	NO ₂	CF ₃	H	semikri- stallin
1.25	CF ₂ CHF ₂	CH ₃	H	CF ₃	NO ₂	H	
1.26	CF ₂ CHF ₂	CH ₃	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
1.27	CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
1.28	C ₂ F ₅	H	H	CF ₃	NO ₂	Na	
1.29	CF ₂ CHF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
1.30	C ₃ F ₇	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
1.31	CF ₂ CHF ₂	Cl	H	NO ₂	CF ₃	H	Smp. 108-109
1.32	CF ₂ CHF ₂	Cl	H	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 207-208

Tabelle 2



Nr.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	physik. Konstanten [°C]
2.1	CH ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 115-116
2.2	C ₂ H ₅	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
2.3	n-C ₃ H ₇	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
2.4	i-C ₃ H ₇	H	H	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 129-132
2.5		H	H	CF ₃	NO ₂	H	
2.6	CH=CH ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
2.7	CH ₂ Cl	H	H	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 139-140
2.8	CHCl ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
2.9	SEt	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
2.10	CCl ₂ CHCl ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 133-135
2.11	CCl ₂ CCl ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
2.12	CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
2.13	CF ₂ CHF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 91-93
2.14	CF ₂ CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
2.15	C ₃ F ₇	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
2.16	CH(CF ₃) ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	Sirup
2.17	C ₇ F ₁₅	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
2.18	CF ₂ Cl	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
2.19	CFCl ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 165-167
2.20	CF ₂ CHCl ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
2.21	CF ₂ CHClF	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
2.22	CF=CH ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 103-105
2.23	CF=CF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
2.24	CCl=CCl ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	

1. Fortsetzung der Tabelle 2

5	Nr.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	physik.
								Konstanten [°C]
10	2.25	OE _t	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 149-151
	2.26	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 146-147
	2.27	n-C ₃ H ₇	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
15	2.28	i-C ₃ H ₇	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.29	—	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.30	CH=CH ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
20	2.31	CH ₂ Cl	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.32	CHCl ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.33	SCH(CH ₃) ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	Na	
25	2.34	CCl ₂ CHCl ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.35	CCl ₂ CCl ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.36	CF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 137-139
30	2.37	CF ₂ CHF ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.38	CF ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.39	C ₃ F ₇	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
35	2.40	CH(CF ₃) ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.41	C ₇ F ₁₅	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.42	CF ₂ Cl	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 147-148
40	2.43	CFCl ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.44	CF ₂ CHCl ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.45	CF ₂ CHClF	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
45	2.46	CF=CH ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.47	CF=CF ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.48	CCl=CCl ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
50	2.49	CF ₃	H	H	NO ₂	CF ₃	H	Smp. 115-116
	2.50	CF ₃	Cl	H	NO ₂	CF ₃	H	
	2.51	CF ₂ CHF ₂	H	H	NO ₂	CF ₃	H	Smp. 106-107
55	2.52	CF ₂ CF ₃	H	Cl	NO ₂	CF ₃	H	
	2.53	Cl	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 176-177
	2.54	OCH ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 157-158
55	2.55	CH ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.56	C ₂ H ₅	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	

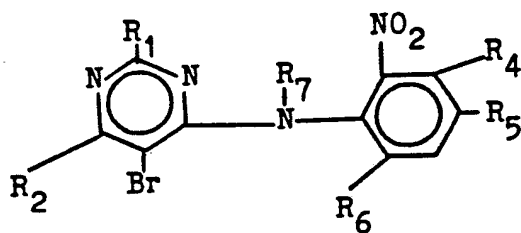
2. Fortsetzung der Tabelle 2

	Nr.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	physik. Konstanten [°C]
5	2.57	H	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
10	2.58	H	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
	2.59	CF ₂ CHF ₂	CH ₃	H	CF ₃	NO ₂	H	
	2.60	CF ₂ CHF ₂	CH ₃	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
15	2.61	CF ₂ CF ₃	CH ₃	H	CF ₃	NO ₂	H	
	2.62	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.63	C≡N	CH ₃	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
20	2.64	C≡N	CH ₃	H	CF ₃	NO ₂	H	
	2.65	C≡N	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
	2.66	C≡N	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.67	◁	H	Cl	CF ₃	NO ₂	K	
25	2.68	CHCl ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
	2.69	CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
	2.70	CF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	Na	
30	2.71	CF ₂ CHF ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	K	Smp. 272-274
	2.72	CF ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	K	Smp. 276-279
	2.73	CFCl ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	K	
35	2.74	CClF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	K	Smp. 271-273
	2.75	CClF ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	K	Smp. 273-276
	2.76	CF ₂ CHF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	K	Smp. 267-270
	2.77	CF ₂ CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	K	Smp. 273-275
40	2.78	CH ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	Na	
	2.79	CH ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
	2.80	C ₃ F ₇	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
45	2.81	CClF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
	2.82	C ₇ F ₁₅	Cl	Cl	CF ₃	NO ₂	K	
	2.83	C ₇ F ₁₅	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
50	2.84	C ₇ F ₁₅	H	H	CF ₃	NO ₂	Na	
	2.85	CF ₂ CHF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	Na	
	2.86	CF ₂ CHF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	Li	
55	2.87	CF ₂ CHCl ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	K	
	2.88	CF ₂ CHCl ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
	2.89	CF ₂ CHCl ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	Na	

3. Fortsetzung der Tabelle 2

5	Nr.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	physik.
								Konstanten [°C]
10	2.90	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	H	NO ₂	CF ₃	H	93-99
	2.91	CF ₂ CHF ₂ CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
	2.92	CF ₂ CHF ₂ CF ₃	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
15	2.93	CF ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.94	CHF(CF ₃) ₂	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
	2.95	CCl ₂ CHCl ₂	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
	2.96	C ₇ F ₁₅	H	H	NO ₂	CF ₃	H	Sirup
20	2.97	C ₇ F ₁₅	H	Cl	NO ₂	CF ₃	H	
	2.98	CHF ₂	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
	2.100	C ₆ F ₁₃	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
25	2.101	C ₆ F ₁₃	H	Cl	NO ₂	CF ₃	H	
	2.102	C ₆ F ₁₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
	2.103	C ₈ F ₁₇	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
30	2.104	C ₈ F ₁₇	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.105	C ₈ F ₁₇	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
	2.106	C ₈ F ₁₇	H	Cl	NO ₂	CF ₃	H	
	2.107	CF ₂ Cl	H	H	NO ₂	CF ₃	H	Smp. 105-107
35	2.108	CFC ₂	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
	2.109	CF ₂ CHCl ₂	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
	2.110	CF ₂ CHClF	H	H	NO ₂	CF ₃	H	Smp. 91-93
40	2.111	CF ₂ CHF ₂	H	H	NO ₂	CF ₃	K	Smp. 271-275
	2.112	CFBrCF ₃	H	H	NO ₂	CF ₃	H	Smp. 135-137
	2.113	CFBrCF ₃	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
45	2.114	CFBrCF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
	2.115	CFBrCF ₃	H	Cl	NO ₂	CF ₃	H	
	2.116	CF ₂ CF ₂ Br	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
50	2.117	CF ₂ CF ₂ Br	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
	2.118	C ₆ H ₅	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 181-183
	2.119	C ₆ F ₅	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
	2.120	C ₆ H ₅	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
55	2.121	C ₆ F ₅	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
	2.122	C ₆ F ₅	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	

Tabelle 3



Nr.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	physik.
							Konstanten [°C]
3.1	CH ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 88-90
3.2	CHCl ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
3.3	CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
3.4	CF ₂ CHF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
3.5	CCl ₂ CHCl ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
3.6	CCl ₂ CCl ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 154-155
3.7	CCl ₂ CCl ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
3.8	CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
3.9	CF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
3.10	CF ₂ CHF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
3.11	CF ₂ CHF ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
3.12	CF ₂ CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
3.13	CF ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
3.14	CF ₂ CHCl ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
3.15	CF ₂ CHCl ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
3.16	CF ₂ CHFCl	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
3.17	CF ₂ CHFCl	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
3.18	CF ₂ CHFCl	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
3.19	CF ₃	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
3.20	C≡N	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
3.21	C≡N	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
3.22	CHCl ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
3.23	CF ₂ CHF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	Na	
3.24	CF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	K	
3.25	CClF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
3.26	CBrF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
3.27	CClF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	Na	

5

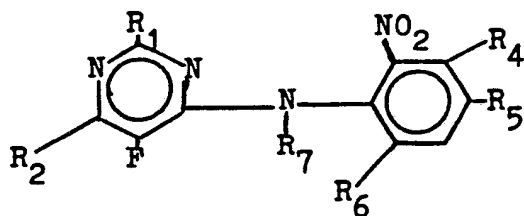
1. Fortsetzung der Tabelle 3

10

Nr.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	physik.
							Konstanten
							[°C]
3.28	CF ₂ CHF ₂	H	H	NO ₂	CF ₃	H	Smp. 94-95
3.29	CF ₂ CF ₃	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
3.30	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
3.31	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
3.32	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	Cl	NO ₂	CF ₃	H	
3.33	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
3.34	CF ₂ CHF ₂ CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
3.35	CF ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
3.36	CF ₂ CHF ₂ CF ₃	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
3.37	(CF ₂) ₆ CF ₃	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
3.38	(CF ₂) ₆ CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
3.39	(CF ₂) ₆ CF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
3.40	(CF ₂) ₆ CF ₃	H	Cl	NO ₂	CF ₃	H	
3.41	CF ₂ CHCl ₂	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
3.42	CF ₂ CHCl ₂	H	Cl	NO ₂	CF ₃	H	
3.43	CClF ₂	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
3.44	CClF ₂	H	Cl	NO ₂	CF ₃	H	
3.45	(CF ₂) ₅ CF ₃	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
3.46	(CF ₂) ₅ CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 171-179
3.47	CClF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
3.48	Cl	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
3.49	CH ₃	H	H	NO ₂	CF ₃	H	Smp. 147-148
3.50	C ₆ F ₅	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
3.51	C ₆ F ₅	H	H	CF ₃	NO ₂	H	

55

Tabelle 4



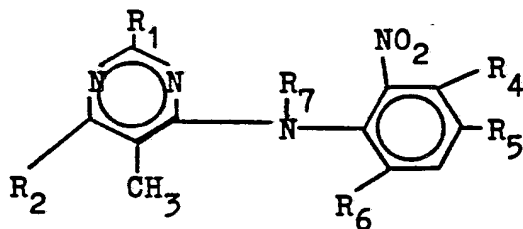
Nr.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	physik. Konstanten [°C]
4.1	CF ₃	CH ₃	H	CF ₃	NO ₂	K	
4.2	CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
4.3	CF ₂ CHF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
4.4	CF ₂ CHF ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
4.5	Cl	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 167-168
4.6	OCH ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 158-159
4.7	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 135-138
4.8	C≡N	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
4.9	C≡N	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	

5

Tabelle 5

10

15



20

Nr.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	physik. Konstanten [°C]
-----	----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	-------------------------------

25

5.1 CH₃ H Cl CF₃ NO₂ H5.2 H H CF₃ NO₂ H5.3 CF₂CHF₂ H H CF₃ NO₂ K

30

5.4 CF₃ H Cl CF₃ NO₂ H5.5 CCl₂CCl₃ H Cl CF₃ NO₂ H5.6 CF₂CHF₂ H Cl CF₃ NO₂ K

35

5.7 CF₂CF₃ H Cl CF₃ NO₂ H5.8 CF₂CHF₂ H Cl CF₃ NO₂ H Smp. 135-1375.9 CF₃ H H CF₃ NO₂ H5.10 CF₂CHF₂ H H CF₃ NO₂ H Smp. 139-140

40

5.11 CF₂CF₃ H H CF₃ NO₂ H5.12 CF₂CF₂CF₃ H H CF₃ NO₂ H5.13 H H H CF₃ NO₂ H

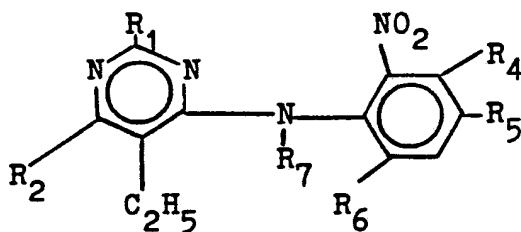
45

5.14 SCH₃ Cl Cl CF₃ NO₂ H Smp. 169-1725.15 SCH₃ Cl H CF₃ NO₂ H Smp. 213-2165.16 SCH₃ Cl H NO₂ CF₃ H Smp. 158-160

50

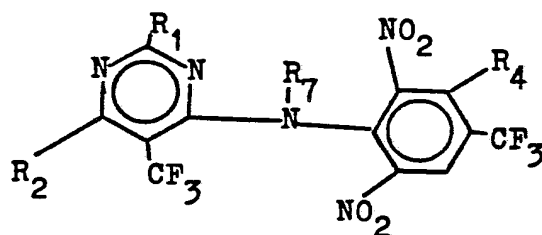
5.17 C≡N H H CF₃ NO₂ H5.18 C≡N H Cl CF₃ NO₂ H5.19 Cl Cl Cl CF₃ NO₂ H Smp. 184-1875.20 Cl Cl H NO₂ CF₃ H Smp. 207-208

55

Tabelle 6

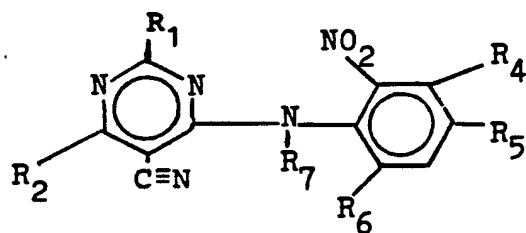
Nr.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	physik. Konstanten [°C]
6.1	CF ₃	CH ₃	H	CF ₃	NO ₂	K	Smp. 134-136
6.2	CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
6.3	CF ₂ CHF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
6.4	CF ₂ CHF ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	Na	
6.5	CF ₂ CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
6.6	CH ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
6.7	CH ₃	Cl	H	CF ₃	NO ₂	K	

Tabelle 7



Nr.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	physik. Konstanten [°C]
7.1	CCl ₂ CCl ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
7.2	H	Cl	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
7.3	CH ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
7.4	CClF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	Na	
7.5	CF ₂ CHF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
7.6	C ₇ F ₁₅	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
7.7	C≡N	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
7.8	C≡N	H	Cl	CF ₃	NO ₂	K	
7.9	CH ₃	OCH ₃	H	CF ₃	NO ₂	H	
7.10	CH ₃	OCH ₃	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 91-95
7.11	CH ₃	OCH ₃	Cl	CF ₃	NO ₂	K	Smp. 111-115
7.12	CH ₃	OCH ₃	H	CF ₃	NO ₂	K	Smp. 109-110

Tabelle 8



Nr.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	physik. Konstanten [°C]
8.1	H	H	H	CF ₃	NO ₂	H	Smp. >260
8.2	CF ₂ CHF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
8.3	CF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
8.4	CF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
8.5	CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 131-132
8.6	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
8.7	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
8.8	CF ₂ CHFC1	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
8.9	CF ₂ CHCl ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 185-186
8.10	CF ₂ CHF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
8.11	CF ₂ CHF ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
8.12	Δ	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
8.13	Δ	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 160-162
8.14	CH ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
8.15	CH ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
8.16	Δ	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
8.17	Δ	H	Cl	CF ₃	NO ₂	K	Smp. 280-281
8.18	CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	NO ₂	H	
8.19	CF ₃	CF ₃	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
8.20	C≡N	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
8.21	C≡N	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 280-281
8.22	CH ₃	H	H	NO ₂	CF ₃	H	
8.23	CH ₃	H	Cl	NO ₂	CF ₃	H	
8.24	CH ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
8.25	CH ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	K	

5

10

15

20

1. Fortsetzung der Tabelle 8

25

Nr.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	physik. Konstanten [°C]
-----	----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	-------------------------------

30

35

8.26	CF ₂ CHF ₂	H	H	NO ₂	CF ₂	H	Smp. 158-159
8.27	CClF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 155-157
8.28	CClF ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 137-140
8.29	CClF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	K	Smp. >260

40

45

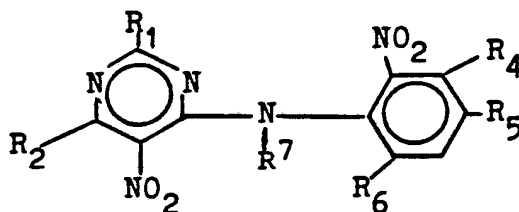
50

55

5

Tabelle 9

10



15

20

25

30

35

40

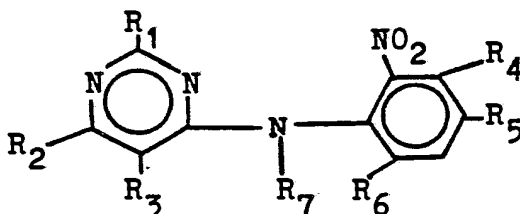
45

50

55

Nr.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	physik. Konstanten [°C]
9.1	CH ₃	H	Cl	NO ₂	CF ₃	K	
9.2	C≡N	H	H	NO ₂	CF ₃	Na	
9.3	CF ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
9.4	CF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
9.5	C ₂ F ₅	H	H	CF ₃	NO ₂	K	
9.6	C ₂ F ₅	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
9.7	CF ₂ CHF ₂	H	H	CF ₃	NO ₂	H	
9.8	CF ₂ CHF ₂	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	
9.9	OCH ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 178-179
9.10	O(CH ₂) ₂ OCH ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 125-126
9.11	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 138-139
9.12	H	OCH ₃	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 184-186
9.13	H	NH ₂	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 187-189
9.14	H	SCH ₃	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 185
9.15	H	OCH ₂ CF ₃	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 164-167
9.16	SCH ₃	OCH ₃	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 181-183
9.17	SCH ₃	NH ₂	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 250 (Zers.)
9.18	OCH ₃	OCH ₃	Cl	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 164-166

Tabelle 10



Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇
10.1	CF ₃	H	CH ₂ OEt	Cl	CF ₃	NO ₂	H
10.2	CF ₃	H	CH ₂ Br	H	CF ₃	NO ₂	H
10.3	CF ₃	H	CH ₂ Cl	H	CF ₃	NO ₂	H
10.4	CF ₃	H	CH ₂ Br	Cl	CF ₃	NO ₂	H
10.5	CF ₃	H	CH ₂ Cl	Cl	CF ₃	NO ₂	H
10.6	CF ₃	CH ₃	CHCl ₂	H	CF ₃	NO ₂	H
10.7	CF ₂ CHF ₂	H	J	H	CF ₃	NO ₂	K
10.8	CF ₂ CHF ₂	H	J	H	CF ₃	NO ₂	H
10.9	CF ₂ CF ₃	H	J	H	CF ₃	NO ₂	Na
10.10	CF ₂ CF ₃	H	J	Cl	CF ₃	NO ₂	K

Beispiel 11.1

N-(3-Chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethyl-phenyl)-2-trichlormethyl-4-pyrimidinylamin

Zu einer Lösung von 17,0 g (0,08 mol) 4-Amino-2-trichlormethylpyrimidin in 500 ml wasserfreiem THF wurden bei -5 °C 22,4 g (0,4 mol) KOH-Pulver gefügt. Anschließend tropfte man eine Lösung von 24,4 g (0,08 mol) 2,4-Dichlor-3,5-dinitro-benzotrifluorid in 100 ml abs. THF so hinzu, daß die Temperatur nicht über 0 °C stieg. Nach 5-stündiger Nachrührzeit wurden die festen Bestandteile abgesaugt und das Lösungsmittel i. Vak. eingedampft. Der Rückstand wurde in Wasser aufgenommen und mit verdünnter Salzsäure angesäuert. Der ausgefallene Feststoff wurde abgesaugt, getrocknet und aus Diisopropylether umkristallisiert. Smp.: 81-83 °C

Beispiel 11.42

Kalium 5-Cyano-N-(2,6-dinitro-4-trifluormethyl-phenyl)-2-trichlormethyl-4-pyrimidinyl-aminat

Zu einer Lösung von 5,9 g (0,025 mol) 4-Amino-2-trichlormethyl-pyrimidin-carbonitril-(5) in 50 ml wasserfreiem THF wurden bei -5 °C 7,0 g (0,125 mol) KOH-Pulver gefügt. Danach tropfte man eine Lösung von 6,8 g (0,025 mol) 4-Chlor-3,5-dinitro-benzotrifluorid in 50 ml abs. THF innerhalb von 30 Minuten so hinzu, daß die Temperatur nicht über 0 °C stieg. Man ließ 4 h nachrühren, saugte die festen Bestandteile ab und

dampfte das Lösungsmittel im Vakuum ab. Der Rückstand wurde in Wasser aufgenommen und mit Chloroform extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Na_2SO_4 getrocknet und im Vakuum eingeeengt. Man erhielt einen dunkelroten Feststoff, der aus Ethylacetat umkristallisiert wurde. Smp.: 239-242 °C

- 5 • Analog Beispiel 11.1 lassen sich die Verbindungen 11.2 bis 11.41 sowie 11.68 bis 11.70 synthetisieren und analog Beispiel 11.41 die Verbindungen 11.43 bis 11.67 sowie 11.71 herstellen (siehe Tabelle 11).

10

15

20

25

30

35

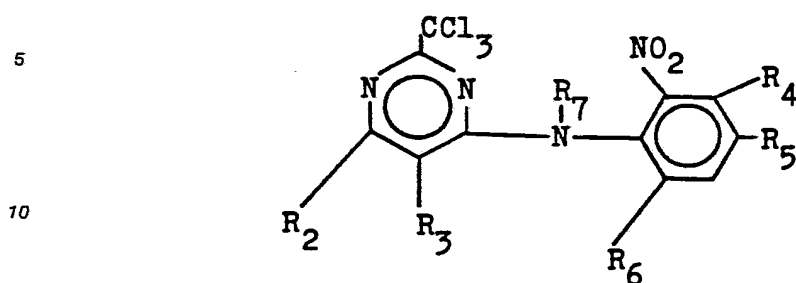
40

45

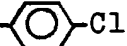
50

55

Tabelle 11



15

Nr.	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	physik. Konstanten [°C]
<hr/>							
20	11.1	H	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H Smp. 81-83
	11.2	H	H	H	CF ₃	NO ₂	H
	11.3	CH ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	H Smp. 172-73
25	11.4	CH ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H
	11.5	Cl	H	H	CF ₃	NO ₂	H
	11.6	Cl	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H
30	11.7	H	H	H	NO ₂	CF ₃	H Smp. 60-62
	11.8	H	H	Cl	NO ₂	CF ₃	H
	11.9	H	Cl	H	CF ₃	NO ₂	H Smp. 139-42
35	11.10	H	Cl	Cl	CF ₃	NO ₂	H
	11.11	H	Cl	H	NO ₂	CF ₃	H Smp. 159-60
	11.12	CH ₃	Cl	H	CF ₃	NO ₂	H Smp. 153-55
40	11.13	CH ₃	Cl	Cl	CF ₃	NO ₂	H Smp. 158-59
	11.14	ClCH ₂	Cl	H	CF ₃	NO ₂	H
	11.15	ClCH ₂	Cl	Cl	CF ₃	NO ₂	H
	11.16	Cl	Cl	H	CF ₃	NO ₂	H Smp. 132-35
45	11.17	Cl	Cl	Cl	CF ₃	NO ₂	H
	11.18	NHMe	Cl	Cl	CF ₃	NO ₂	H
	11.19	NHEt	Cl	Cl	CF ₃	NO ₂	H
50	11.20	NHMe	Cl	H	CF ₃	NO ₂	H
	11.21	NHEt	Cl	H	CF ₃	NO ₂	H
	11.22	NMe ₂	Cl	H	CF ₃	NO ₂	H
55	11.23	NMe ₂	Cl	Cl	CF ₃	NO ₂	H
	11.24	-o-  -Cl	F	H	NO ₂	CF ₃	H

1. Fortsetzung der Tabelle 11

	Nr.	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇ physik. Konstanten [°C]
5							
10							
	11.25	H	Br	H	CF ₃	NO ₂	H
	11.26	H	Br	Cl	CF ₃	NO ₂	H
15	11.27	Cl	Br	H	CF ₃	NO ₂	H Smp. 138-141
	11.28	Cl	Br	Cl	CF ₃	NO ₂	H Smp. 110-112
	11.29	H	F	H	CF ₃	NO ₂	H
	11.30	H	F	Cl	CF ₃	NO ₂	H
20	11.31	H	CH ₃	Cl	CF ₃	NO ₂	H
	11.32	H	CH ₃	H	CF ₃	NO ₂	H
	11.33	H	Et	H	CF ₃	NO ₂	H
25	11.34	H	Et	Cl	CF ₃	NO ₂	H
	11.35	H	CF ₃	H	CF ₃	NO ₂	H
	11.36	H	C≡N	H	CF ₃	NO ₂	H Smp. 144-145
30	11.37	H	C≡N	Cl	CF ₃	NO ₂	H
	11.38	H	NO ₂	H	CF ₃	NO ₂	H
	11.39	H	NO ₂	Cl	CF ₃	NO ₂	H
	11.40	Cl	C≡N	H	CF ₃	NO ₂	H
35	11.41	Cl	C≡N	Cl	CF ₃	NO ₂	H
	11.42	H	C≡N	H	CF ₃	NO ₂	K Smp. 239-242
	11.43	H	H	H	CF ₃	NO ₂	K semikrist.
40	11.44	H	H	Cl	CF ₃	NO ₂	K Smp. 213-215
	11.45	CH ₃	H	H	CF ₃	NO ₂	K Smp. 115-118
	11.46	CH ₃	H	Cl	CF ₃	NO ₂	K Smp. 59-60
45	11.47	Cl	H	H	CF ₃	NO ₂	K Smp. 203-105
	11.48	Cl	H	Cl	CF ₃	NO ₂	K
	11.49	OMe	CH ₃	Cl	CF ₃	NO ₂	H
	11.50	H	H	H	NO ₂	CF ₃	K
50	11.51	H	Cl	H	CF ₃	NO ₂	K Smp. 163-166
	11.52	H	Cl	Cl	CF ₃	NO ₂	K Smp. 227-230
	11.53	CH ₃	Cl	H	CF ₃	NO ₂	K Smp. 211-213
55	11.54	OEt	Et	Cl	NO ₂	CF ₃	Li
	11.55	H	Br	H	CF ₃	NO ₂	K Smp. 173-175

2. Fortsetzung der Tabelle 11

5

Nr.	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	physik.
							Konstanten [°C]
11.56	H	Br	Cl	CF ₃	NO ₂	K	Smp. 250-253
11.57	Cl	Cl	H	CF ₃	NO ₂	K	
11.58	Cl	Cl	Cl	CF ₃	NO ₂	K	
11.59	H	CH ₃	Cl	CF ₃	NO ₂	K	Smp. 68-72
11.60	H	CH ₃	H	CF ₃	NO ₂	K	Smp. 63-66
11.61	NHMe	Cl	Cl	CF ₃	NO ₂	Na	
11.62	NHEt	Cl	Cl	CF ₃	NO ₂	Na	
11.63	NMe ₂	Cl	H	CF ₃	NO ₂	Na	
11.64	H	Cl	H	CF ₃	NO ₂	COCH ₃	
11.65	H	Cl	H	CF ₃	NO ₂	COCH ₂ Cl	
11.66	H	Br	H	CF ₃	NO ₂	CO- -Cl	
11.67	H	Cl	H	CF ₃	NO ₂	Na	
11.68	H	Br	H	NO ₂	CF ₃	H	Smp. 146-149
11.69	Cl	Br	H	NO ₂	CF ₃	H	Smp. 139-141
11.70	Cl	Br	H	CF ₃	NO ₂	H	Smp. 135-136
11.71	CH ₃	Cl	Cl	CF ₃	NO ₂	K	Smp. 107-110

40 Et = Ethyl

C. Biologische Beispiele

45

1. Insektizidie WirkungBeispiel 1

50 Mit Bohnenspinnmilben (*Tetranychus urticae*, Vollpopulation) stark befallene Bohnenpflanzen (*Phaseolus v.*) wurden mit der wäßrigen Verdünnung eines Emulsionskonzentrates, das 1000 ppm des jeweiligen Wirkstoffes enthielt, gespritzt. die Mortalität der Milben wurde nach 7 Tagen kontrolliert. 100 % Abtötung wurde mit den Verbindungen gemäß Beispiel 2.12, 11.53, 2.74, 2.51, 2.111, 5.10, 3.10, 3.47, 11.68, 11.27, 2.90, 1.32, 3.28, 11.11, 2.107, 2.72 und 2.77 erzielt.

55

Beispiel 2

Mit Obstbaumspeinnmilben (*Panonychus ulmi*) stark befallene Apfelbäumchen (*Malus communis*) wurden wie Beispiel 1 behandelt.

- 5 Die Mortalität der Milben wurden nach 8 Tagen kontrolliert. 100 % Abtötung wurde mit den Verbindungen gemäß Beispiel 2.12, 2.74, 2.18, 2.111, 2.107, 5.10, 3.10, 3.47, 11.68, 11.27, 2.90, 1.32, 2.21, 3.28, 2.72, 2.77 und 11.51 erzielt.

10 Beispiel 3

Mit Kundeböhenblattlaus (*Aphis craccivora*) stark besetzte Ackerböhen (*Vicia faba*) wurden mit wäßrigen Verdünnungen von Spritzpulverkonzentraten mit 1000 ppm Wirkstoffgehalt bis zum Stadium des beginnenden Abtropfens besprüht. Die Mortalität der Blattläuse wurde nach 3 Tagen bestimmt. Eine 100

- 15 %ige Abtötung konnte mit den Verbindungen gemäß Beispiel 2.12, 8.14, 8.24, 2.36, 11.71, 2.75, 2.111, 3.48, 2.107, 5.10, 3.10, 3.47, 1.68, 2.90, 1.32, 2.21, 1.196, 3.28, 11.11, 2.72, 2.77 und 11.51 erzielt werden.

Beispiel 4

20

Mit Weisser Fliege (*Traletrodes vaporariorum*) stark besetzte Böhenpflanzen wurden mit wäßrigen Suspensionen von Spritzpulverkonzentraten (1000 ppm Wirkstoffgehalt) bis zum beginnenden Abtropfen gespritzt. Nach Aufstellung der Pflanzen im Gewächshaus erfolgte nach 14 Tagen die mikroskopische Kontrolle mit dem Ergebnis jeweils 100 %iger Mortalität bei den Präparaten mit den Wirkstoffen der

- 25 Beispiele 11.9, 2.13, 2.12, 2.36, 8.27, 11.71, 11.16, 7.11, 2.75, 2.74, 7.11, 11.13, 11.12, 2.18, 2.42, 2.51, 2.111, 3.48, 2.107, 3.10, 3.47, 11.68, 2.90, 2.21, 1.196, 3.28, 2.71, 2.72, 2.76, 2.77, 11.51 und 11.55 erzielt.

Beispiel 5

30

Auf die Innenseite des Deckels und des Bodens einer Petrischale werden jeweils 1 ml der zu testenden Formulierung emulgiert in Wasser gleichmäßig aufgetragen und nach dem Antrocknen des Belages jeweils 10 Imagines der Hausfliege (*Musca domestica*) eingegeben. Nach dem Verschließen der Schale werden diese bei Raumtemperatur aufbewahrt und nach 3 Stunden die Mortalität der Versuchstiere bestimmt. Bei

- 35 1000 ppm (bezogen auf den Gehalt an Wirkstoff) zeigten die Präparate 2.12, 3.48, 5.10, 2.1, 11.3, 3.10, 3.47, 11.68, 11.27, 1.32, 5.8, 3.1, 2.21, 1.196, 3.28, 11.11, 2.76, 11.51 und 11.55 eine 100 %ige Wirkung.

Beispiel 6

40

In eine wie in Beispiel 5 behandelte Petrischale werden je 10 Larven (L4) der Deutschen Schabe (*Blatella germanica*) gesetzt, die Schalen verschlossen und nach 5 Tagen die Mortalität der Versuchstiere bestimmt.

Bei 1000 ppm (bezogen auf den Gehalt an Wirkstoff) zeigten die Präparate 2.12, 8.27, 8.29, 2.107, 5.10, 3.10, 3.47, 11.68, 2.90, 2.21, 1.196, 3.28, 11.51 und 11.55 eine 100 %ige Wirkung.

45

Beispiel 7

50 Auf die Innenseite des Bodens einer Petrischale wurden 1 Lage Filterpapier und darauf eine ca. 3-5 ml große Menge halbsynthetische Futterdiät aufgebracht. Nach dem Erkalten wird die zu testende Formulierung mit Wasser auf die Oberfläche des Futters und des Filterpapiers in fallenden Konzentrationen gesprüht und nach dem Antrocknen des Spritzbelages je 10 Larven (L3-L4) des gemeinen Baumwollwurms (*Prodenia litura*) eingesetzt.

- 55 Die mit Deckel verschlossenen Petrischalen wurden 7 Tage bei Raumtemperatur aufbewahrt und danach die Mortalität der Versuchstiere ermittelt.

Bei 100 ppm (bezogen auf den Gehalt an Wirkstoff) zeigten die Präparate 2.76, 2.77, 11.55 2.13, 2.12, 2.74, 2.18, 3.10, 3.47, 11.68, 2.90, 2.21, 11.11. eine 100 %ige Wirkung.

Beispiel 8

In vitro-Test an tropischen Rinderzecken (*Boophilus microplus*)

- 5 In folgender Versuchsanordnung ließ sich die Wirksamkeit der beanspruchten Verbindungen gegen Zecken nachweisen: Zur Herstellung einer geeigneten Wirkstoffzubereitung wurden die Wirkstoffe 10 %ig (G/V) in einer Mischung, bestehend aus Dimethylformamid (85 g), Nonylphenylpolyglykoether (3 g) und oxethyliertes Rizinusöl (7 g), gelöst und die so erhaltenen Emulsionskonzentrate mit Wasser auf die Prüfkonzentrationen verdünnt.
- 10 In diese Wirkstoffverdünnungen wurden jeweils zehn vollgesogene Weibchen der tropischen Zecke, *Boophilus microplus*, für fünf Minuten eingetaucht. Die Zecken wurden anschließend auf Filterpapier getrocknet und dann zum Zwecke der Eiablage mit der Rückseite auf einer Klebefolie befestigt. Die Aufbewahrung der Zecken erfolgte im Wärmeschrank bei 28 °C und einer Luftfeuchtigkeit von 90 %.
- Zur Kontrolle wurden Zeckenweibchen lediglich in Wasser eingetaucht.
- 15 Zur Bewertung der Wirksamkeit wurde zwei Wochen nach der Behandlung die Hemmung der Eiablage herangezogen. Dabei besagen 100 %, daß keine, 0 % daß alle Zecken Eier abgelegt haben.
- In diesem Test bewirkten die Verbindungen 11.51, 11.55 und 2.77 in Wirkstoffkonzentrationen von 0,1 % (G/V) jeweils eine 100 % Hemmung der Eiablage.

20

Beispiel 9

Insektizide Wirkung von Kombinationen mit Endosulfan

- 25 Zum Nachweis eines synergistischen Effektes der zu untersuchenden Verbindungen wurden 3 Serien von Versuchen parallel durchgeführt. In je einer Serie wurden die beiden Kombinationspartner alleine in fallenden Konzentrationen in mit künstlicher Futterdiät ausgegossenen Petrischalen entsprechend 600 l/ha gesprüht und nach dem Antrocknen des Spitzbelages je 10 Larven (L3) von *Spodoptera littoralis* pro Schale eingesetzt. In einer dritten Serie wurden die Schalen zuerst mit dem einen Kombinationspartner in oben ge-
- 30 schildeter Weise behandelt und nach dem Abtrocknen die Schalen mit dem zweiten Kombinationspartner zusätzlich in gleicher Weise behandelt. Nach dem Abtrocknen des zweiten Belages wurden wie in der ersten und zweiten Serie je Schale 10 Larven (L3) der genannten Tierart eingesetzt.
- Es zeigte sich (Tabelle I), daß die Wirkung der kombinierten Behandlung, bezogen auf die jeweils angewandte Dosierung, weit mehr als die additive Wirkung der Einzelpartner beträgt.

35

Tabelle I:

40	Bsp.Nr. Vbg I 11.11 (A)	Komb.partner Endosulfan (B)	Wirkung der Einzel- komponente	Wirkung der Kombination
45	(Konz. in ppm)		(% Mortalität der Larven)	
		A	B	A+B
	63	500	50	0
	31	250	0	0
	16	125	0	0
50				

50

Beispiel 10

- 55 Eine staubförmige Formulierung wurde mit Erde gemischt, die mit *Meloidogyne incognita* verseucht war. Anschließend erfolgte das Abfüllen in Töpfe und die Bepflanzung dieser mit Tomaten. Nach einer Standzeit von 4 Wochen im Gewächshaus wurden die Wertzahlen nach folgendem Schema ermittelt:

	Gallen/Pflanze	Wertzahl
	0	1
5	1-2	2
	3-5	3
	6-10	4
10	über 150	9

Mit einer Aufwandmenge von 15 ppm der Wirkstoffe aus Beispiel 8.2, 2.51, 2.111 und 2.107 wurde Wertzahl 1 (= 100 % Wirkung) erzielt.

2. Fungizidie Wirkung

Beispiel 11

Biomalzar wurde mit den beanspruchten Verbindungen (Tabelle II und III) in Konzentrationen von jeweils 2000 und 500 ppm Wirkstoff versetzt. Nach dem Erstarren des Agars erfolgte die Beimpfung mit verschiedenen *Botrytis cinerea*-Kulturen, die Benzimidazol- und Iprodion-sensibel bzw. -resistent sind. Jeweils 20 µl einer Sporensuspension wurden auf das Zentrum der Agarplatte aufgebracht. Die Versuche wurden 6 Tage nach Beimpfung ausgewertet. Der Wirkungsgrad der Wirkstoffe wird ausgedrückt in % im Vergleich zur Kontrolle (Agarmedium ohne Wirkstoff).

5

Tabelle II

10

Botrytis cinerea, BCM- und
Iprodion-sensibler Stamm

15

20

25

30

Verbindung gemäß Bei- spiel Nr.	Wirkungsgrad in % bei ppm Wirkstoff	
	2000	500
11.16	100	100
11.42	100	80
11.51	100	100
11.55	100	100
11.60	100	50
11.45	100	50
11.44	100	100
11.52	100	100
11.56	100	80
11.59	100	100
11.46	100	100
11.71	100	50
Kontrolle	0	

Tabelle III

35

Botrytis cinerea, BCM- und
Iprodion-resistenter Stamm

40

45

50

55

Verbindung gemäß Bei- spiel Nr.	Wirkungsgrad in % bei ppm Wirkstoff	
	2000	500
11.16	100	100
11.42	100	50
11.51	100	100
11.55	100	80
11.60	100	50
11.45	100	50
11.44	100	100
11.52	100	100
11.56	100	100
11.59	100	100
11.46	100	100
11.71	100	50
Kontrolle	0	

Beispiel 12

Biomalzagar wird mit den beanspruchten Verbindungen (Tabelle IVa und IVb) in Konzentrationen von jeweils 125, 30 und 8 ppm Wirkstoff versetzt. Nach dem Erstarren des Agars erfolgt die Beimpfung mit Pseudocercospora-Kulturen (BCM-sensibel und BCM-resistent). Jeweils 20 µl einer Sporensuspension werden auf das Zentrum der Agarplatte aufgebracht. Die Versuche werden 6 Tage nach Beimpfung ausgewertet. Der Wirkungsgrad der Wirkstoffe wird ausgedrückt in % im Vergleich zur Kontrolle (Agarmedium ohne Wirkstoff).

Tabelle IVa

Verbindung gemäß Bei- spiel Nr.	Wirkungsgrad gegenüber Pseudo- cercospora herpotrichoides in % bei ppm Wirkstoff BCM-sensibler Stamm		
	125	30	8
11.42	100	100	100
11.51	100	100	100
11.55	100	100	100
11.45	100	80	—
11.44	100	100	100
11.56	100	100	100
11.59	100	100	80
11.46	100	100	80
Kontrolle	0		

Tabelle IVb

Verbindung gemäß Bei- spiel Nr.	Wirkungsgrad gegenüber Pseudocercospora herpotrichoides in % bei ppm Wirkstoff					
	BCM-sensibler Stamm			BCM-resistenter Stamm		
	125	30	8	125	30	8
11.68	100	100	100	100	100	100
11.27	100	100	100	100	100	100
11.1	100	100	100	—	—	—
11.71	100	100	100	100	100	100
11.16	100	100	100	100	100	100
11.47	100	100	100	100	100	100

Beispiel 13

Weinpflanzen, die aus Stecklingen der Plasmopara-anfälligen Sorte Müller-Thurgau gezogen waren, wurden im 4-Blattstadium mit wäßrigen Suspensionen der beanspruchten Verbindungen tropfnaß behandelt. Die Anwendungskonzentrationen betragen 500, 250 und 125 mg Wirkstoff pro Liter Spritzbrühe.

Nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen mit einer Zoosporangiensuspension von *Plasmopara viticola* inokuliert und tropfnaß in eine Klimakammer bei einer Temperatur von ca. 20 °C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 100 % gestellt. Nach 24 Stunden wurden die infizierten Pflanzen der Klimakammer entnommen und in ein Gewächshaus mit einer Temperatur von ca. 23 °C und einer Luftfeuchtigkeit von ca. 80-90 % gebracht.

Nach einer Inkubationszeit von 7 Tagen wurden die Pflanzen über Nacht in die Klimakammer gestellt und die Krankheit zum Ausbruch gebracht. Anschließend erfolgt die Befallsauswertung. Der Befallsgrad wurde in % befallener Blattfläche im Vergleich zu den unbehandelten, infizierten Kontrollpflanzen ausgedrückt und ist in Tabelle V wiedergegeben.

Tabelle V

Verbindung gemäß Bei- spiel Nr.	% <i>Plasmopora viticola</i> - Befall bei ppm Wirkstoff		
	500	250	125
11.42	0	0	0-3
11.51	0	0	0
11.55	0	0	0
11.44	0	0	0-3
11.52	0	0	0
11.59	0	0-3	3
11.46	0	0	0
11.47	0	0	0-3
11.16	0	0	0
11.1	0	0	0
11.68	0	0	0
unbehandelte, infizierte Pflanzen		100	

Beispiel 14

Apfelunterlagen (EM IX) wurden im 4-Blattstadium mit den beanspruchten Verbindungen in den Anwendungskonzentrationen von 500, 250 und 125 mg Wirkstoff/Liter Spritzbrühe gleichmäßig behandelt.

Nach Antrocknen des Wirkstoffbelages wurden Pflanzen mit Konidien des Apfelschorfs (*Venturia inaequalis*) stark inokuliert und tropfnaß in eine Klimakammer gestellt, deren Temperatur ca. 22 °C und deren relative Luftfeuchtigkeit ca. 100 % betrug. Nach einer Infektionszeit von 48 Stunden kamen die Pflanzen in ein Gewächshaus mit ca. 18 °C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von 95-100 %.

Nach einer Inkubationszeit von 14 Tagen wurden die Pflanzen auf Befall mit Apfelschorf (*Venturia inaequalis*) untersucht. Die Beurteilung des Befalls erfolgte wie üblich nach Augenschein. Der Befallsgrad der Pflanzen mit Apfelschorf wurde in % befallener Blattfläche, bezogen auf unbehandelte, infizierte Pflanzen, ausgedrückt und ist in Tabelle VI wiedergegeben.

Tabelle VI

Verbindung gemäß Bei- spiel Nr.	% Schorfbefall bei ppm Wirkstoff		
	500	250	125
11.51	0	0	0
11.55	0	0	0
11.60	0	0	0
11.45	0	0	0
11.56	0	0	0-3
11.46	0	0	0-3
unbehandelte, infizierte Pflanzen		100	

Beispiel 15

Fungizide synergistische Wirkung von Kombinationen

Kreuzstreifen-Test (Methode in J. Gen. Microbiol 126 (1981), Seite 1-7) in Petrischalen.

Filterpapierstreifen (10 mm breit und 90 mm lang) wurden mit den formulierten Wirkstoffen der Formel I und dem Kombinationspartner (Iprodion) in verschiedenen Konzentrationen gleichmäßig benetzt (ca. 200 µl/Streifen) und auf ein je nach Pilzart unterschiedliches Agar-Medium aufgelegt. Dem Agar wurden zuvor in noch flüssigen Zustand zu Petrischale 0,5 ml Suspensionskultur des Testorganismus (ca. 10⁵-10⁶ Konidien/ml) zugegeben. Jede Petrischale enthielt einen Filterpapierstreifen mit je einem Vertreter der Formel I und senkrecht dazu einem zweiten Streifen mit dem Kombinationspartner. Die Wirkstoffkonzentrationen wurden durch entsprechende Vorversuche mit den Einzelkomponenten so gewählt, daß die gegenüber dem betreffenden Testorganismus der sogenannten minimalen Hemmstoffkonzentration entsprachen.

Nach ca. 3-4-tägiger Inkubation der Petrischalen bei 22-25°C wurden die Inhibitionszonen im Bereich der sich kreuzenden Teststreifen diametral ausgemessen und die Hemmzone als Maß für den Synergismus bewertet.

Tabelle VII

5

Kreuzstreifen-Test

Testobjekt: *Botrytis cinerea*

10

Wirkstoff bzw. Kombinationen	Konz. Wirkstoff ppm	Hemmzonen in mm
---------------------------------	------------------------	--------------------

15

Bsp. 11.51 a)	500	0
---------------	-----	---

b)	250	0
----	-----	---

Iprodion c)	500	8
-------------	-----	---

20

d)	250	0
----	-----	---

Wirkstoffkom- a+c	500+500	18
-------------------	---------	----

binationen a+d	500+250	8
----------------	---------	---

25

b+c	250+500	12
-----	---------	----

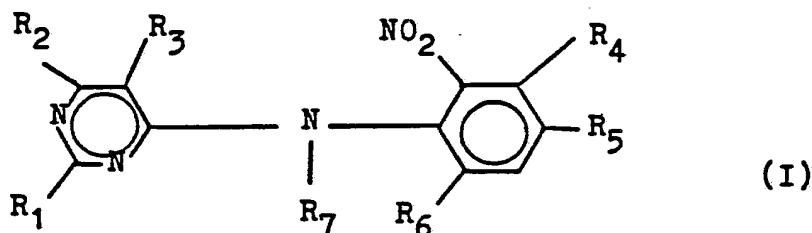
b+d	250+250	8
-----	---------	---

30 Ansprüche

1. Schädlingsbekämpfungsmittel, dadurch gekennzeichnet, daß sie eine Verbindung der Formel (I)

35

40



worin

45 R₁ und R₂ unabhängig voneinander Wasserstoff; Halogen; Cyano; (C₁-C₈)-Alkyl; (C₁-C₈)-Haloalkyl; (C₁-C₈)-Alkyl, das ein-oder zweifach durch Nitro, Cyano, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio oder -N(R₈)(R₉) substituiert ist; (C₃-C₈)-Cycloalkyl, das durch (C₁-C₄)-Alkyl substituiert sein kann; (C₂-C₄)-Alkenyl; (C₂-C₄)-Haloalkenyl; (C₅-C₈)-Cycloalkenyl; eine Gruppe N(R₈)(R₉); (C₁-C₈)-Alkylthio; (C₁-C₈)-Alkoxy; (C₁-C₈)-Haloalkoxy; (C₁-C₈)-Alkylsulfonyl; Phenyl, das gegebenenfalls durch Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio oder (C₁-C₄)-Haloalkyl substituiert sein kann oder Phenoxy, das ein-bis dreifach durch Halogen, NO₂, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy substituiert sein kann;

50

R₃ Wasserstoff, Halogen; (C₁-C₈)-Alkyl; (C₁-C₈)-Haloalkyl; (C₂-C₄)-Alkenyl; (C₂-C₄)-Haloalkenyl; (C₁-C₄)-Alkoxy; (C₁-C₄)-Alkylthio; Cyano; Nitro; Phenyl, das ein-bis dreifach durch Halogen, Nitro, Cyano; (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio oder (C₁-C₄)-Haloalkyl substituiert sein kann; oder Phenoxy, das ein-bis dreifach durch Halogen, NO₂, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy substituiert sein kann,

55

R₄ Wasserstoff, Halogen, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, eine Gruppe N(R₈)(R₉) oder Phenoxy, das ein-bis dreifach durch Halogen, Nitro, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy substituiert sein kann;

R₅ und R₆ unabhängig voneinander Nitro oder CF₃;

R₇ Wasserstoff, eine Gruppe -COR₁₀ oder ein Kationäquivalent,

R_8 und R_9 unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁-C₄)-Alkyl oder (C₃-C₇)-Cycloalkyl und R_{10} Wasserstoff oder (C₁-C₄)-Alkyl bedeuten, enthalten.

2. Mittel gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß in Formel I R_1 , R_2 = (C₁-C₈)-Alkyl, (C₁-C₈)-Haloalkyl; (C₁-C₈)-Alkyl, das ein-oder zweifach durch Nitro, Cyano, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio oder -N-(R_8)(R_9) substituiert ist, (C₃-C₈)-Cycloalkyl, das durch (C₁-C₄)-Alkyl substituiert sein kann; (C₂-C₄)-Alkenyl; (C₂-C₄)-Haloalkenyl; Phenyl, das gegebenenfalls durch Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio oder (C₁-C₄)-Haloalkyl substituiert sein kann oder,

R_3 Wasserstoff, Halogen; (C₁-C₈)-Alkyl; (C₁-C₈)-Haloalkyl; Cyano oder Phenoxy, das ein-bis dreifach durch Halogen, NO₂, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy substituiert sein kann;

R_4 Wasserstoff; Halogen, (C₁-C₄)-Alkoxy oder (C₁-C₄)-Alkylthio;

R_5 und R_6 unabhängig voneinander Nitro oder CF₃;

R_7 Wasserstoff, eine Gruppe -COR₁₀ oder ein Kationäquivalent;

R_8 und R_9 unabhängig voneinander Wasserstoff; (C₁-C₄)-Alkyl oder (C₃-C₇)-Cycloalkyl und

R_{10} Wasserstoff oder (C₁-C₄)-Alkyl bedeuten.

3. Mittel gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß in Formel I, R_1 (C₁-C₈)-Haloalkyl, R_2 Wasserstoff, R_3 Halogen, R_4 Wasserstoff, R_5 und R_6 unabhängig voneinander NO₂ oder CF₃ und R_7 Wasserstoff bedeuten.

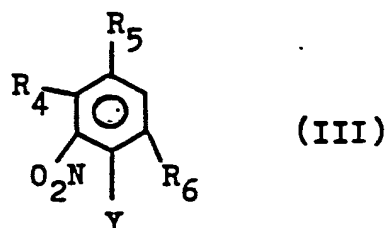
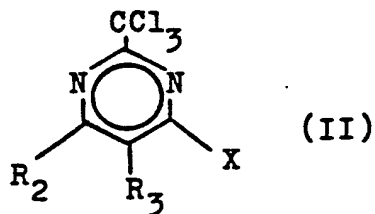
4. Verfahren zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen insbesondere Schadinsekten dadurch gekennzeichnet, daß man auf diese oder die von ihnen befallenen Pflanzen oder Anbauflächen eine wirksame Menge eines Mittels gemäß Ansprüchen 1, 2 oder 3 appliziert.

5. Verwendung von Verbindung der Formel I von Ansprüchen 1, 2 oder 3 zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen.

6. Verbindungen der Formel I, worin R_1 CCl₃ bedeutet und die übrigen Reste die Definitionen wie in Anspruch 1, 2 oder 3 besitzen.

7. Verbindungen der Formel I, von Anspruch 6, worin R_1 = CCl₃, R_2 = Halogen, (C₁-C₈)-Alkyl, (C₁-C₈)-Haloalkyl; R_3 = H, Halogen oder Cyano; R_4 H = oder Halogen; R_5 , R_6 = Nitro oder CF₃ und R_7 = H bedeuten.

8. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I von Anspruch 6 oder 7, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel II mit einer Verbindung der Formel III



wobei X, Y = Halogen oder NH₂ bedeuten, wobei im Falle X = Halogen Y = NH₂ und im Falle X = NH₂ Y = Halogen sein muß, in Gegenwart einer Base umsetzt.

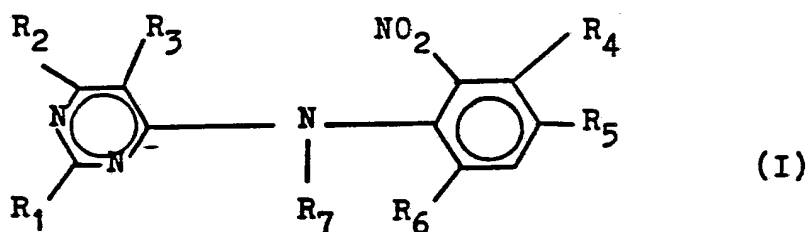
9. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man auf diese oder die von ihnen befallenen Pflanzen oder Anbauflächen eine wirksame Menge einer Verbindung von Anspruch 6 oder 7 appliziert.

Patentansprüche für die folgenden Vertragsstaaten: Österreich und Spanien.

1. Schädlingsbekämpfungsmittel, dadurch gekennzeichnet, daß sie eine Verbindung der Formel (I)

5

10



15

worin

R₁ und R₂ unabhängig voneinander Wasserstoff; Halogen; Cyano; (C₁-C₈)-Alkyl; (C₁-C₈)-Haloalkyl; (C₁-C₈)-Alkyl, das ein-oder zweifach durch Nitro, Cyano, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio oder -N(R₈)(R₉) substituiert ist; (C₃-C₈)-Cycloalkyl, das durch (C₁-C₄)-Alkyl substituiert sein kann; (C₂-C₄)-Alkenyl; (C₂-C₄)-Haloalkenyl; (C₅-C₆)-Cycloalkenyl; eine Gruppe N(R₈)(R₉); (C₁-C₈)-Alkylthio; (C₁-C₈)-Alkoxy; (C₁-C₈)-Haloalkoxy; (C₁-C₈)-Alkylsulfonyl; Phenyl, das gegebenenfalls durch Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio oder (C₁-C₄)-Haloalkyl substituiert sein kann oder Phenoxy, das ein-bis drei fach durch Halogen, NO₂, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy substituiert sein kann;

R₃ Wasserstoff, Halogen; (C₁-C₈)-Alkyl; (C₁-C₈)-Haloalkyl; (C₂-C₄)-Alkenyl; (C₂-C₄)-Haloalkenyl; (C₁-C₄)-Alkoxy; (C₁-C₄)-Alkylthio; Cyano; Nitro; Phenyl, das ein-bis dreifach durch Halogen, Nitro, Cyano; (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio oder (C₁-C₄)-Haloalkyl substituiert sein kann; oder Phenoxy, das ein-bis dreifach durch Halogen, NO₂, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy substituiert sein kann,

R₄ Wasserstoff, Halogen, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, eine Gruppe N(R₈)(R₉) oder Phenoxy, das ein-bis dreifach durch Halogen, Nitro, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy substituiert sein kann;

R₅ und R₆ unabhängig voneinander Nitro oder CF₃;

R₇ Wasserstoff, eine Gruppe -COR₁₀ oder ein Kationäquivalent,

R₈ und R₉ unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁-C₄)-Alkyl oder (C₃-C₇)-Cycloalkyl und

R₁₀ Wasserstoff oder (C₁-C₄)-Alkyl bedeuten, enthalten.

2. Mittel gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß in Formel I R₁, R₂ = (C₁-C₈)-Alkyl, (C₁-C₈)-Haloalkyl; (C₁-C₈)-Alkyl, das ein-oder zweifach durch Nitro, Cyano, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio oder -N(R₈)(R₉) substituiert ist, (C₃-C₈)-Cycloalkyl, das durch (C₁-C₄)-Alkyl substituiert sein kann; (C₂-C₄)-Alkenyl; (C₂-C₄)-Haloalkenyl; Phenyl, das gegebenenfalls durch Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio oder (C₁-C₄)-Haloalkyl substituiert sein kann oder,

R₃ Wasserstoff, Halogen; (C₁-C₈)-Alkyl; (C₁-C₈)-Haloalkyl; Cyano oder Phenoxy, das ein-bis dreifach durch Halogen, NO₂, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy substituiert sein kann;

R₄ Wasserstoff; Halogen, (C₁-C₄)-Alkoxy oder (C₁-C₄)-Alkylthio;

R₅ und R₆ unabhängig voneinander Nitro oder CF₃;

R₇ Wasserstoff, eine Gruppe -COR₁₀ oder ein Kationäquivalent;

R₈ und R₉ unabhängig voneinander Wasserstoff; (C₁-C₄)-Alkyl oder (C₃-C₇)-Cycloalkyl und

R₁₀ Wasserstoff oder (C₁-C₄)-Alkyl bedeuten.

45

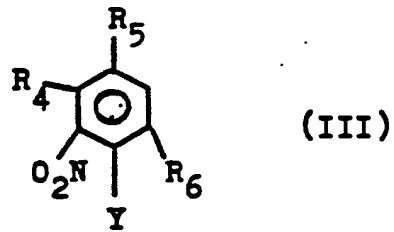
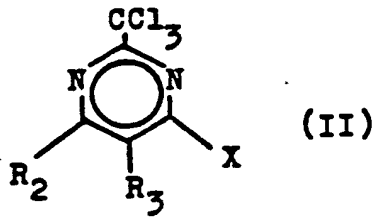
3. Mittel gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß in Formel I, R₁ (C₁-C₈)-Haloalkyl, R₂ Wasserstoff, R₃ Halogen, R₄ Wasserstoff, R₅ und R₆ unabhängig voneinander NO₂ oder CF₃ und R₇ Wasserstoff bedeuten.

4. Verfahren zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen insbesondere Schadinsekten dadurch gekennzeichnet, daß man auf diese oder die von ihnen befallenen Pflanzen oder Anbauflächen eine wirksame Menge eines Mittels gemäß Ansprüchen 1, 2 oder 3 appliziert.

5. Verwendung von Verbindung der Formel I von Ansprüchen 1, 2 oder 3 zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen.

6. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I von Anspruch 1, 2 oder 3 worin R₁ = CCl₃ bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel II mit einer Verbindung der Formel III

5



10 wobei X, Y = Halogen oder NH₂ bedeuten, wobei im Falle X = Halogen Y = NH₂ und im Falle X = NH₂ Y = Halogen sein muß in Gegenwart einer Base umgesetzt.

7. Verfahren gemäß Anspruch 6, dadurch gekennzeichnet, daß R₁ = CCl₃, R₂ Halogen, (C₁-C₈)-Alkyl, (C₁-C₈)-Haloalkyl; R₃ = H, Halogen oder Cyano; R₄ = H oder Halogen; R₅, R₆ = Nitro oder CF₃ und R₇ = H bedeuten.

15 8. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man auf diese oder die von ihnen befallenen Pflanzen oder Anbauflächen eine wirksame Menge einer Verbindung von Anspruch 6 oder 7 appliziert.

20

25

30

35

40

45

50

55



EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE			EP 87107729.3														
Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, der maßgeblichen Teile	Betrifft Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int. Cl. 4)														
X	EP - A1 - O 126 254 (CIBA-GEIGY AG) * Ansprüche 1,12,13,18 * --	1,8	A 01 N 43/54 C 07 D 239/42														
D,X	EP - A1 - O 139 613 (CIBA-GEIGY AG) * Ansprüche 1,10,12 * --	1,8															
A	EP - A1 - O 067 630 (SANKKO COMPANY LIMITED) * Zusammenfassung * ----	8															
			RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (Int. Cl. 4)														
			A 01 N C 07 D 239/00														
Der vorliegende Recherchenbericht wurde für alle Patentansprüche erstellt.																	
Recherchenort WIEN		Abschlußdatum der Recherche 02-09-1987	Prüfer SCHNASS														
<table border="0"><tr><td>KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTEN</td><td>E : älteres Patentedokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist</td></tr><tr><td>X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet</td><td>D : in der Anmeldung angeführtes Dokument</td></tr><tr><td>Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie</td><td>L : aus andern Gründen angeführtes Dokument</td></tr><tr><td>A : technologischer Hintergrund</td><td></td></tr><tr><td>O : nichtschriftliche Offenbarung</td><td></td></tr><tr><td>P : Zwischenliteratur</td><td></td></tr><tr><td>T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze</td><td>& : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument</td></tr></table>				KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTEN	E : älteres Patentedokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist	X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet	D : in der Anmeldung angeführtes Dokument	Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie	L : aus andern Gründen angeführtes Dokument	A : technologischer Hintergrund		O : nichtschriftliche Offenbarung		P : Zwischenliteratur		T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze	& : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument
KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTEN	E : älteres Patentedokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist																
X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet	D : in der Anmeldung angeführtes Dokument																
Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie	L : aus andern Gründen angeführtes Dokument																
A : technologischer Hintergrund																	
O : nichtschriftliche Offenbarung																	
P : Zwischenliteratur																	
T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze	& : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument																